(1) Veröffentlichungsnummer: 0 456 063 A2

(Z)

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

21) Anmeldenummer: 91106870.8

2 Anmeldetag: 27.04.91

(i) Int. Cl.5: **C07D** 207/408, C07D 207/38, C07D 403/12, C07D 207/404, C07D 405/12, A01N 43/36

Priorität: 10.05.90 DE 4014941 08.03.91 DE 4107394

Veröffentlichungstag der Anmeldung: 13.11.91 Patentblatt 91/46

Benannte Vertragsstaaten: BE CH DE ES FR GB GR IT LI NL

71 Anmelder: BAYER AG

W-5090 Leverkusen 1 Bayerwerk(DE)

(72) Erfinder: Krauskopf, Birgit, Dr. Kicke 19 W-5060 Bergisch Gladbach 1(DE) Erfinder: Lürssen, Klaus, Dr.

August-Kierspel-Strasse 151

W-5060 Bergisch Gladbach(DE)

Erfinder: Santel, Hans-Joachim, Dr.

Gruenstrasse 9a

W-5090 Leverkusen 1(DE)

Erfinder: Schmidt, Robert R., Dr.

Im Waldwinkel 110

W-5060 Bergisch Gladbach(DE) .

Erfinder: Wachendorff-Neumann, Ulrike, Dr.

Kriescherstrasse 81 W-4019 Monhelm(DE) Erfinder: Fischer, Reiner, Dr. Nelly-Sachs-Strasse 23 W-4019 Monheim 2(DE)

Erfinder: Erdelen, Christoph, Dr.

Unterbuescherhof 22 W-5653 Leichlingen 1(DE)

(54) 1-H-3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate.

Es werden neue 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der allgemeinen Formel (I)

bereitgestellt, in welcher

für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl steht,

Ζ für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

für eine Zahl von 0-3 steht,

für Wasserstoff oder für die Gruppen

-CO-R1, -CO-O-R2 oder E9

steht, in welchen

für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, Polyalkoxyalkyl und Cycloalkyl, das durch Heteroatome unterbrochen sein kann, gegebenenfalls subst. Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylalkyl, substituiertes Hetaryl, substituiertes Phenoxyalkyl und substituiertes Hetaryloxyalkyl steht und

- R² für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl und gegebenenfalls substituiertes Phenyl steht,
- A für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gegebenenfalls durch Heteroatome unterbrochenes Cycloalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen-, Alkyl-, Halogenalkyl-, Alkoxy-, Nitro substituiertes Aryl, Arylalkyl oder Hetaryl steht,
- B für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht,

oder worin

A und B gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind einen Carbocyclus bilden und für ein Metallionäquivalent oder ein Ammoniumion steht,

sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (I).

Die neuen Verbindungen der Formel (I) besitzen eine hervorragende herbizide, insektizide und akarizide Wirksamkeit.

Die Erfindung betrifft neue 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate, mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Insektizide, Akarizide und Herbizide.

Von 3-Acyl-pyrrolidin-2,4-dionen sind pharmazeutische Eigenschaften vorbeschrieben (S. Suzuki et. al. Chem. Pharm. Bull. 15 1120 (1967)). Weiterhin wurden N-Phenyl-pyrrolidin-2,4-dione von R. Schmierer und H. Mildenberger Liebigs Ann. Chem. 1985 1095 synthetisiert. Eine biologische Wirksamkeit dieser Verbindungen wurde nicht beschrieben.

In EP-A 0 262 399 werden ähnlich strukturierte Verbindungen (3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dione) offenbart, von denen jedoch keine herbizide, insektizide oder akarizide Wirkung bekannt geworden ist.

In DE-A 3 525 109 werden ähnlich strukturierte 1-H-3-Arylpyrrolidin-2,4-dione offenbart, die als Zwischenprodukte für Farbstoffsynthesen verwendet wurden.

Es wurden nun neue 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate gefunden, die durch die Formel (I) dargestellt sind,

15

20

25

30

in welcher

X für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

Y für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl steht,

Z für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

n für eine Zahl von 0-3 steht,

R für Wasserstoff oder für die Gruppen -CO-R¹, -CO-O-R² oder E^e

steht, in welchen

- R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, Polyalkoxyalkyl und Cycloalkyl, das durch Heteroatome unterbrochen sein kann, gegebenenfalls subst. Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylalkyl, substituiertes Hetaryl, substituiertes Phenoxyalkyl und substituiertes Hetaryloxyalkyl steht und
- R² für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl und gegebenenfalls substituiertes Phenyl steht,
- 35 A für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gegebenenfalls durch Heteroatome unterbrochenes Cycloalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen-, Alkyl-, Halogenalkyl-, Alkoxy-, Nitro substituiertes Aryl, Arylalkyl oder Hetaryl steht.
 - B für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht,

40 oder worin

45

50

55

A und B gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind einen Carbocyclus bilden und

E* für ein Metallionäquivalent oder ein Ammoniumion steht,

sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (I).

Im folgenden seien die folgenden Untergruppen definiert:

(la): Verbindungen der Formel (l) worin R = Wasserstoff,

(lb): Verbindungen der Formel (l) worin R = COR1,

(Ic): Verbindungen der Formel (I) worin R = COOR².

(Id): Verbindungen der Formel (I) worin R = E^e für ein Metallionäquivalent oder ein Ammoniumion steht.

Weiterhin wurde gefunden, daß man 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dione bzw. deren Enole der Formel (la)

in welcher A, B, C, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben, erhält, wenn man

(A)

N-Acylaminosäureester der Formel (II)

5

10

$$\begin{array}{c|c}
A & CO_2R^3 \\
\hline
H & N & Z_n \\
\hline
0 & Y
\end{array}$$

15 in welcher

A, B, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben und

R3 für Alkyl steht,

in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart einer Base intramolekular kondensiert.

20 (B)
Außerdem wurde gefunden, daß man Verbindungen der Formel (lb)

25

$$\begin{array}{c|c}
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\$$

30

in welcher A, B, X, Y, Z, R¹ und n die oben angegebene Bedeutung haben, erhält, wenn man Verbindungen der Formel (la),

35

40

45

55

in welcher

A, B, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben,

α) mit Säurehalogeniden der allgemeinen Formel (III)

in welcher

R¹ die oben angegebene Bedeutung hat und

Hal für Halogen, insbesondere Chlor und Brom steht, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels,

oder

β) mit Carbonsäureanhydriden der allgemeinen Formel (IV)

R1-CO-O-CO-R1 (IV)

in welcher

R¹ die oben angegebene Bedeutung hat, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels,

umsetzt,

(C)

Ferner wurde gefunden, daß man Verbindungen der Formel (lc)

15

20

5

1Ò

$$\begin{array}{c|c}
 & 0 \\
 & \parallel \\$$

25 in welche

A, B, C, X, Y, Z, R² und n die oben angegebene Bedeutung haben, erhält, wenn man Verbindungen der Formel (la)

30

35

in welcher

A, B, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben, mit Chlorameisensäureester der allgemeinen Formel (V)

40 R2-O-CO-CI (V)

in welcher

R² die oben angegebene Bedeutung hat, gegebenenfals in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt.

D١

Weiterhin wurde gefunden, daß man Verbindungen der Formel (I)

50

45

$$A \xrightarrow{B} 0^{\Theta} X \xrightarrow{Z_{n}} Y \qquad (Id)$$

55

in welcher X, Y, Z, A, B und n die oben angegebene Bedeutung haben,

erhält, wenn man Verbindungen der Formel (la)

$$A \xrightarrow{B} HO X$$

$$H \xrightarrow{N} O$$

$$(Ia)$$

in welcher X, Y, Z, A, B und n die oben angegebene Bedeutung haben, mit Metallhydroxiden oder Aminen der allgemeinen Formeln (VI) und (VII)

15
 1

20 in welchen

5

10

25

30

35

45

50

55

Me für ein- oder zweiwertige Metallionen,

s und t für die Zahlen 1 und 2 und

R⁴, R⁵ und R⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff und Alkyl

stehen.

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, umsetzt.

Überraschenderweise wurde gefunden, daß die neuen 3-Arylpyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I) sich durch hervorragende insektizide, akarizide und herbizide Wirkungen auszeichnen.

Bevorzugt sind 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I), in welcher

X für C₁-C₆-Alkyl, Halogen, C₁-C₆-Alkoxy steht,

Y für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Halogen, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkyl steht,

Z für C₁-C₆-Alkyl, Halogen, C₁-C₆-Alkoxy steht,

n für eine Zahl von 0-3 steht,

R für Wasserstoff (la) oder für die Gruppen der Formel

$$-CO-R^1$$
 oder $-CO-O-R^2$ oder E^{Θ} (Ib) (Ic) (Id)

steht, in welchen

R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes: C₁-C₂₀-Alkyl, C₂-C₂₀-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Alkylthio-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Polyalkoxy-C₂-C₈-alkyl und Cycloalkyl mit 3-8 Ringatomen, das durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann, steht,

für gegebenenfalls durch Halogen-, Nitro-, C_1 - C_6 -Alkyl-, C_1 - C_6 -Alkoxy-, C_1 - C_6 -Halogenalkyl-, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy-substituiertes Phenyl;

für gegebenenfalls durch Halogen-, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-, C₁-C₆-Halogenalkyl-, C₁-C₆-Halogenalkoxy-substituiertes Phenyl-C₁-C₆-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen- und C₁-C₆-Alkyl-substituiertes Hetaryl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen- und C_1 - C_6 -Alkyl-substituiertes Phenoxy- C_1 - C_6 -alkyl steht, für gegebenenfalls durch Halogen, Amino und C_1 - C_6 -Alkyl-substituiertes Hetaryloxy- C_1 - C_6 -Alkyl steht.

R² für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes: C₁-C₂₀-Alkyl, C₂-C₂₀-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Polyalkoxy-C₂-C₈-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen-, Nitro-, C_1 - C_6 -Alkyl-, C_1 - C_6 -Alkoxy-, C_1 - C_6 -Halogenalkyl-substituiertes Phenyl steht,

A für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkinyl, C₁-C₁₀-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Polyalkoxy-C₂-C₈-

alkyl, C_1 - C_{10} -Alkylthio- C_2 - C_6 -alkyl, Cycloalkyl mit 3-8 Ringatomen, das durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch Halogen, C_1 - C_6 -Alkyl- C_1 - C_6 -Haloalkyl-, C_1 - C_6 -Alkoxy-, Nitro substituiertes Aryl, Hetaryl oder Aryl- C_1 - C_6 -alkyl steht,

für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes C1-C12-Alkyl, C1-C8-Alkoxyalkyl steht,

B fi oder worin

20

30

40

50

A und B gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 3 bis 8-gliedrigen Ring bilden,

E^e für ein Metallionenäquivalent oder ein Ammoniumion steht, sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (I).

10 Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I) in welcher

X für C1-C4-Alkyl, Halogen, C1-C4-Alkoxy steht,

Y für Wasserstoff, C1-C6-Alky!, Halogen, C1-C4-Alkoxy, C1-C2-Halogenalkyl steht,

Z für C₁-C₄-Alkyl, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy steht,

n für eine Zahl von 0-3 steht,

15 R für Wasserstoff (la) oder für die Gruppen der Formel

$$-CO-R^1$$
 oder $-CO-O-R^2$ oder E^Θ
(Ib) (Ic) (Id)

steht, in welchen

für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes: C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₆-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkylthio-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Polyalkoxy-C₂-C₆-alkyl und Cycloalkyl mit 3-7 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff- und/oder Schwefelatome unterbrochen sein kann steht, für gegebenenfalls durch Halogen-, Nitro-, C₁-C₄-Alkyl-, C₁-C₄-Alkoxy-, C₁-C₃-Halogenalkyl-, C₁-C₃-Halogenalkyl-steht, für gegebenenfalls durch Halogen-, C₁-C₄-Alkyl-, C₁-C₄-Alkoxy-, C₁-C₃-Halogenalkyl-, C₁-C₃-

für gegebenenfalls durch Halogen-, C₁-C₄-Alkyl-, C₁-C₄-Alkoxy-, C₁-C₃-Halogenalkyl-, C₁-C₃-Halogenalkyl-,

für gegebenenfalls duch Halogen- und C1-C6-Alkyl-substituiertes Hetaryl steht,

gegebenenfalls für durch Halogen- und C1-C4-Alkyl-substituiertes Phenoxy-C1-C5-alkyl steht,

für gegebenfalls durch Halogen, Amino und C₁-C₄-Alkyl-substituiertes Hetaryloxy-C₁-C₅-alkyl steht.

für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes: C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₆-Alkenyl, C₁-C₁₆-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Polyalkoxy-C₂-C₆-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen, Nitro-, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy-, C₁-C₃-Halogenalkyl-substituiertes Phenyl steht,

A für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₁₀-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Polyalkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₈-Alkylthio-C₂-C₆-alkyl, Cycloalkyl mit 3-7 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff- und/oder Schwefelatomen unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch Halogen-, C₁-C₄-Alkyl-, C₁-C₄-Haloalkyl-C₁-C₄-Alkoxy-, Nitro substituiertes Aryl, Hetaryl oder Aryl-C₁-C₄-alkyl steht,

B für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₁₀-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxyalkyl steht,

45 oder worin

A und B gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 3 bis 7-gliedrigen Ring bilden,

für ein Metallionenäquivalent oder ein Ammoniumion steht

sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (I).

Ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I) in welcher

X für Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy und Ethoxy steht,

Y für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl, Butyl, i-Butyl, tert.-Butyl, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy und Trifluormethyl steht,

Z für Methyl, Ethyl, i-Propyl, Butyl, i-Butyl, tert.-Butyl, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy und Ethoxy steht,

55 n für eine Zahl von 0-3 steht,

R für Wasserstoff (la) oder für die Gruppen der Formel

$$-CO-R^1$$
 oder $-CO-O-R^2$ oder E^Θ (Ib) (Ic) (Id)

steht, in welcher

5

10

15

20

30

für gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes: C₁-C₁₄-Alkyl, C₂-C₁₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkoxyl-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₄-Polyalkoxyl-C₂-C₄-alkyl und Cycloalkyl mit 3-6 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff- und/oder Schwefelatome unterbrochen sein kann steht, für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor, Brom-, Methyl-, Ethyl-, Propyl, i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl-, Trifluormethoxy-, Nitro- substituiertes Phenyl steht,

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Brom-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy- substituiertes Phenyl-C₁-C₂-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Brom-, Methyl-, Ethyl-substituiertes Pyridyl, Pyrimidyl, Thiazolyl und Pyrazolyl steht,

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Methyl-, Ethyl-substituiertes Phenoxy-C₁-C₄-alkylsteht, für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Amino-, Methyl-, Ethyl-, substituiertes Pyridyloxy-C₁-C₄-alkyl, Pyrimidyloxy-C₁-C₄-alkyl und Thiazolyloxy-C₁-C₄-alkyl steht,

R² für gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₁₄-Alkyl, C₂-C₁₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₄-Polyalkoxy-C₂-C₆-alkyl steht, oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Nitro, Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl, Methoxy, Ethoxy. Trifluormethyl substituiertes Phenyl steht.

A für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₄-Alkenyl, C₃-C₄-Alkinyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₄-alkyl, C₁-C₆-Polyalkoxy-C₂-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylthio-C₂-C₄-alkyl, Cycloalkyl mit 3-6 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff- und/oder Schwefelatomen unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Brom-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, iso-Propyl-, Methoxy-, Ethoxy-, Trifluormethyl-, Nitro susbtituiertes Aryl, Pyridin, Imidazol, Pyrazol, Triazol, Indol, Thiazol oder Aryl-C₁-C₃-alkyl steht,

B für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxyalkyl steht, oder worin

A und B gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 3 bis 6-gliedrigen Ring bilden,

für ein Metallionenäquivalent oder ein Ammoniumion steht

sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel I.

Verwendet man gemäß Verfahren (A) N-2,6-Dichlorphenylacetyl-alaninethylester,so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:

H₃C C1
$$\frac{1. \text{ Base}}{2.\text{H}^+}$$
 $\frac{1. \text{ Base}}{1. \text{ Base}}$ $\frac{1. \text{ Base}}{1. \text{ Base}}$

Verwendet man gemäß Verfahren (B) (Variante α) 3-(2,4,6-Trimethylphenyl)-5-isopropyl-pyrrolidin-2,4-dion und Pivaloylchlorid als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden.

Verwendet man gemäß Verfahren B (Variante β) 3-(2,4,6-Trimethylphenyl)-5-cyclopentyl-pyrrolidin-2,4- i dion und Acetanhydrid, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden.

Verwendet man gemäß Verfahren C 3-(2,4-6-Trimethylphenyl)-5-phenyl-pyrrolidin-2,4-dion und Chlorameisensäureethoxyethylester, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden.

Verwendet man gemäß Verfahren D 3-(2,4-Dichlorphenyl)-5-(2-indolyl)-pyrrolidin-2,4-dion und Methylamin, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden.

Die bei dem obigen Verfahren (A) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen der Formel (II)

(II) 10

in welcher

5

A, B, X, Y, Z, n und R³ die oben angegebene Bedeutung haben sind teilweise bekannt oder lassen sich nach im Prinzip bekannten Methoden in einfacher Weise herstellen. So erhält man z.B. Acyl-aminosäuree-15 ster der Formel (II), wenn man

a) Aminosäurederivate der Formel (VIII),

20 (VIII)

25 in welcher

30

35

55

R⁷ für Wasserstoff (VIIIa) und Alkyl (VIIIb) steht und

die oben angegebene Bedeutung haben mit Phenylessigsäurehalogeniden der Formel (IX)

(IX)

in welcher

X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben und 40 für Chlor oder Brom steht, acyliert (Chem. Reviews 52 237-416 (1953); oder wenn man Acylaminosäuren der Formel (Ila),

45 (IIa) 50

A, B, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben und

R⁷ für Wasserstoff steht, verestert (Chem. Ind. (London) 1568 (1968).

Beispielhaft seien folgende Verbindungen der Formel (II) genannt:

- 1. N-2,4-Dichlorphenyl-acetyl-glycinethylester
- 2. N-2,6-Dichlorphenyl-acetyl-glycinethylester
- 3. N-(2,6-Dichlorphenyl-acetyl)-alanin-ethylester
- 4. N-(2.6-Dichlorphenyl-acetyl)-valin-ethylester
 - 5. N-(2,6-Dichlorphenyl-acetyl)-leucin-ethylester
 - 6. N-(2,6-Dichlorphenyl-acetyl)-methionin-ethylester
 - 7. N-(2,6-Dichlorphenyl-acetyl)-phenylalanin-ethylester
 - 8. N-(2.6-Dichlorphenyl-acetyl)-tryptophan-ethylester
- 9. N-(2,6-Dichlorphenyl-acetyl)-isoleucin-ethylester
 - 10. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-glycin-methylester
 - 11. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-alanin-ethylester
 - 12. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-valin-ethylester
 - 13. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-leucin-ethylester
- 15 14. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-isoleucin-ethylester
 - 15. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-methionin-ethylester
 - 16. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-phenylalaninethylester
 - 17. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-tryptophan-ethylester
 - 18. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-(4-chlorphenyl)-alanin-ethylester
- 20 19. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-S-methyl-cystein-ethylester
 - 20. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-S-benzyl-cystein-ethylester
 - 21. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-O-methyl-threonin-ethylester
 - 22. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-tert.-butyl-alanin-ethylester
 - 23. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-histidin-ethylester
- 24. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-O-methyl-tyrosin-ethylester
 - 25. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-1-amino-cyclopropan-carbonsäure-methylester
 - 26. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-1-amino-cyclopentan-carbonsäure-methylester
 - 27. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-1-amino-cyclohexan-carbonsäure-methylester
 - 28. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-amino-isobuttersäure-methylester
- 30 29. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-2-ethyl-2-amino-buttersäure-methylester
 - 30. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-2-methyl-2-amino-buttersäure-methylester
 - 31. N-(2.4.6-Trimethylphenyl-acetyl)-2-methyl-2-amino-valeriansäure-methylester
 - 32. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-2,3-dimethyl-2-amino-valeriansäure-methylester Beispielhaft seien folgende Verbindungen der Formel (IIa) genannt:
- 1. N-2,4-Dichlorphenyl-acetyl-glycin

45

- 2. N-2.6-Dichlorphenyl-acetyl-glycin
- 3. N-(2,6-Dichlorphenyl-acetyl)-alanin
- 4. N-(2,6-Dichlorphenyl-acetyl)-valin
- 5. N-(2,6-Dichlorphenyl-acetyl)-leucin
- 40 6. N-(2,6-Dichlorphenyl-acetyl)-methionin
 - 7. N-(2,6-Dichlorphenyl-acetyl)-phenylalanin
 - 8. N-(2,6-Dichlorphenyl-acetyl)-tryptophan
 - 9. N-(2,6-Dichlorphenyl-acetyl)-isoleucin
 - 10. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl-glycin
 - 11. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-alanin
 - 12. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-valin
 - 13. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-leucin
 - 14. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-isoleucin
 - N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-methionin
 N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-phenylalanin
 - 17. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-tryptophan
 - 18. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-(4-chlorphenyl)-alanin
 - 19. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-S-methyl-cystein
 - 20. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-S-benzyl-cystein
- 21. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-O-methyl-threonin
 - 22. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-tert.-butyl-alanin
 - 23. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-histidin
 - 24. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-O-methyl-tyrosin

- 25. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-1-amino-cyclopropancarbonsäure
- 26. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-1-amino-cyclopentancarbonsäure
- 27. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-1-amino-cyclohexancarbonsäure tancarbonsäure
- 28. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-1-amino-isobuttersäure
- 29. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-2-ethyl-2-amino-buttersäure-methylester
 - 30. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-2-methyl-2-amino-buttersäure-methylester
 - 31. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-2-methyl-2-amino-valeriansäure-methylester
 - 32. N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-2,3-dimethyl-2-amino-valeriansäure-methylester

Verbindungen der Formel (IIa) sind beispielsweise aus den Phenylessigsäurehalogeniden der Formel (IX) und Aminosäuren der Formel (VIIIa) nach Schotten-Baumann (Organikum 9. Auflage 446 (1970) VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin) erhältlich.

Verbindungen der Formel (VIIIa) und (VIIIb) sind bekannt oder aber nach im Prinzip bekannten Literaturverfahren einfach herstellbar.

Das Verfahren (A) ist dadurch gekennzeichnet, daß Verbindungen der Formel (II) in welcher A, B, X, Y, 75 Z, n und R³ die oben angegebene Bedeutung haben in Gegenwart von Basen einer intramolekularen Kondensation unterwirft.

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (A) alle üblichen inerten organischen Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Kohlenwasserstoffe, wie Toluol und Xylol, ferner Ether, wie Dibutylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, Glylkoldimethylether und Diglykoldimethylether, außerdem polare Lösungsmittel, wie Dimethylsulfoxid, Sulfolan, Dimethylformamid und N-Methylpyrrolidon.

Als Deprotonierungsmittel können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) alle üblichen Protonenakzeptoren eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Alkalimetall- und Erdalkalimetall-oxide, -hydroxide und -carbonate, wie Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Magnesiumoxid, Calciumoxid, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat, die auch in Gegenwart von Phasentransferkatalysatoren wie z.B. Triethylbenzylammoniumchlorid, Tetrabutylammoniumbromid, Adogen 464 oder TDA 1 eingesetzt werden können. Ferner sind Alkalimetall- und Erdalkalimetallamide und -hydride, wie Natriumamid, Natriumhydrid und Calciumhydrid, und außerdem auch Alkalimetall-alkoholate, wie Natriummethylat und Kalium-tert.-butylat einsetzbar.

Die Recktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) innerhalb, eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 250°C, vorzugsweise zwischen 50°C und 150°C.

Das erfindungsgemäße Verfahren (A) wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) setzt man die Reaktionskomponenten der Formeln (II) und die deprotonierenden Basen im allgemeinen in etwa äquimolaren Mengen ein. Es ist jedoch auch möglich, die eine oder andere Komponente in einem größeren Überschuß (bis zu 3 Mol) zu verwenden.

Das Verfahren (Ba) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (Ia) mit Carbonsäurehalogeniden der Formel (III) umsetzt.

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (Βα) bei Verwendung der Säurehalogenide alle gegenüber diesen Verbindungen inerten Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Kohlenwasserstoffe, wie Benzin, Benzol, Toluol, Xylol und Tetralin, ferner Halogenkohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Chlorbenzol und o-Dichlorbenzol, außerdem Ketone, wie Aceton und Methylisopropylketon, weiterhin Ether, wie Diethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan, darüberhinaus Dimethylsulfoxid und Sulfolan. Wenn die Hydrolysestabilität des Säurehalogenids es zuläßt, kann die Umsetzung auch in Gegenwart von Wasser durchgeführt werden.

Verwendet man die entsprechenden Carbonsäurehalogenide so kommen als Säurebindemittel bei der Umsetzung nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (Βα) alle üblichen Säureakzeptoren in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind tertiäre Amine, wie Triethylamin, Pyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicycloundecen (DBU), Diazabicyclononen (DBN), Hünig-Base und N,N-Dimethyl-anilin, ferner Erdalkalimetalloxide, wie Magnesium- und Calciumoxid, außerdem Alkali- und Erdalkali-metall-carbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat.

Die Reaktionstemperaturen können auch bei dem erfindungsgemäßen Verfahren ($B\alpha$) auch bei der

55

Adogen 464 = Methyltrialkyl(C_a-C₁₀)ammoniumchlorid

Verwendung von Carbonsäurehalogeniden innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und +150°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 100°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (Ba) werden die Ausgangsstoffe der Formel (Ia) und das Carbonsäurehalogenid der Formel (III) im allgemeinen in angenähert äquivalenten Mengen verwendet. Es ist jedoch auch möglich, das Carbonsäureanhydrid in einem größeren Überschuß (bis zu 5 Mol) einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

Das Verfahren (B\$) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (la) mit Carbonsäureanhydriden der Formel (IV) umsetzt.

10

15

45

Verwendet man bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (Bß) als Reaktionskomponente der Formel (IV) Carbonsäureanhydride, so können als Verdünnungsmittel vorzugsweise diejenigen Verdünnungsmittel verwendet werden, die auch bei der Verwendung von Säurehalogeniden vorzugsweise in Betracht kommen. Im übrigen kann auch ein im Überschuß eingesetztes Carbonsäureanhydrid gleichzeitig als Verdünnungsmittel fungieren.

Die Reaktionstemperaturen können auch bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (Bß) auch bei der Verwendung von Carbonsäureanhydriden innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und +150°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 100°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens werden die Ausgangsstoffe der Formel (la) und das Carbonsäureanhydrld der Formel (IV) im allgemeinen in angenähert äquivalenten Mengen verwendet. Es ist jedoch auch möglich, das Carbonsäureanhydrid in einem größeren Überschuß (bis zu 5 Mol) einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

Im allgemeinen geht man so vor, daß man Verdünnungsmittel und im Überschuß vorhandenes Carbonsäureanhydrid sowie die entstehende Carbonsäure durch Destillation oder durch Waschen mit einem organischen Lösungsmittel oder mit Wasser entfernt.

Das Verfahren (C) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (la) mit Chlorameisensäureestern der Formel (V) umsetzt.

Verwendet man die entsprechenden Chlorameisensäureester so kommen als Säurebindemittel bei der Umsetzung nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (C) alle üblichen Säureakzeptoren in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind tertiäre Amine, wie Triethylamin, Pyridin, DABCO, DBC, DBA, Hünig-Base und N,N-Dimethyl-anilin, ferner Erdalkalimetalloxide, wie Magnesium- und Calcium-oxid, außerdem Alkali- und Erdalkali-metall-carbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat.

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (C) bei Verwendung der Chlorameisensäureester alle gegenüber diesen Verbindungen inerten Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Kohlenwasserstoffe, wie Benzin, Benzol, Toluol, Xylol und Tetralin, ferner Halogenkohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Chlorbenzol und o-Dichlorbenzol, außerdem Ketone, wie Aceton und Methylisopropylketon, weiterhin Ether, wie Diethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan, darüberhinaus Carbonsäureester, wie Ethylacetat, und auch stark polare Solventien, wie Dimethylsulfoxid und Sulfolan.

Bei Verwendung der Chlorameisensäureester als Carbonsäure-Derivate der Formel (V) können die Reaktionstemperaturen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Arbeitet man in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und eines Säurebindemittels, so liegen die Reaktionstemperaturen im allgemeinen zwischen -20°C und +100°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 50°C.

Das erfindungsgemäße Verfahren (C) wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) werden die Ausgangsstoffe der Formel (Ia) und der entsprechende (Chlorameisensäureester der Formel (V) im allgemeinen in angenähert äquivalenten Mengen verwendet. Es ist jedoch auch möglich, die eine oder andere Komponente in einem größeren Überschuß (bis zu 2 Mol) einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt dann nach üblichen Methoden. Im allgemeinen geht man so vor, daß man ausgefallene Salze entfernt und das verbleibende Reaktionsgemisch durch Abziehen des Verdünnungsmittels einengt.

Das Verfahren (D) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (la) mit Metallhydroxiden (VI) oder Aminen (VII) umsetzt.

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren vorzugsweise Ether wie Tetrahydrofuran, Dioxan, Diethylether oder aber Alkohole wie Methanol, Ethanol, Isopropanol, aber auch Wasser eingesetzt werden. Das erfindungsgemäße Verfahren (D) wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Die Reaktionstemperatur liegen im allgemeinen zwischen -20°C und 100°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 50°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) werden die Ausgangsstoffe der Formel (la) bzw. (VI = oder (VII) im allgemeinen in angenähert äquimolaren Mengen verwendet. Es ist jedoch auch möglich, die eine oder andere Komponente in einem größeren Überschuß (bis zu 2 Mol) einzusetzen. Im allgemeinen geht man so vor, daß man das Reaktionsgemisch durch Abziehen des Verdünnungsmittels einengt.

Herstellungsbeispiele

Beispiel 1

H₃C OH CH₃ CH₃

20

10

15

124,9 g (0,428 Mol) N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-valinmethylester werden in 430 ml abs. Toluol suspendiert. Nach Zugabe von 51,6 g Kalium-tert.-butylat (95 %ig) wird unter DC-Kontrolle unter Rückfluß erhitzt. Man rührt in 500 ml Eiswasser ein, trennt das Toluol ab und tropft die wäßrige Phase bei 0-20° C in 600 ml 1N HCl. Der Niederschlag wird abgesaugt, getrocknet und aus Chloroform/Methyl-tert.-butyl-Ether/n-Hexan umkristallisiert.

Ausbeute:

51,5 g (= 46,4 % d.Th.) der illustrierten Verbindung Fp. 126 C

Beispiel 2

30

35

$$H_3C$$
 H_3C
 $C=0$
 CH_3
 CH_3
 CH_3

40

5,46 g (20 mmol) 5-Isobutyl-3-(2,4,6-Trimethylphenyl)-pyrrolidin-2,4-dion werden in 70 ml Methyl-tert.-Butyl-Ether suspendiert und mit 3,4 ml (20 mmol) Hünig-Base versetzt. Bei 0-10° C werden 2,52 ml (20 mmol) Pivaloylchlorid in 5 ml Methyl-tert.-butyl-Ether zugetropft und εnschließend unter Dünnschichtchromatographie-Kontrolle weitergerührt. Der Niederschlag wird abgesaugt, nachgewaschen und das Filtrat einrotiert. Nach SC an Klese!gel mit Cyclohexan/Essigester 1:1 und Kristallisation aus Methyl-tert.-butyl-Ether/n-Hexan erhielt man 2,14 g (29,9 % d.Th.) der illustrierten Verbindung vom Schmp. 154° C.

Beispiel 3

$$C_{2}H_{5}$$
 C_{13}
 C_{13}
 C_{13}
 C_{13}
 C_{13}
 C_{13}
 C_{13}
 C_{13}
 C_{13}

4,19 g (20 mmol) 5-Isopropyl-3-(2,4,6-trimethylphenyl)-pyrrolidin-2,4-dion werden in 70 ml Methyl-tert.-butyl-Ether suspendiert und mit 3,4 ml (20 mmol) HÜnig-Base versetzt. Bei -70° C tropft man 1,92 ml (20 mmol) Chlorameisensäure-ethylester in 5 ml Methyl-tert.-butyl-Ether zu und läßt auf Raumtemperatur erwärmen. Nach dem Einrotieren wird der Rückstand in Methylenchlorid aufgenommen, mit Wasser gewaschen, getrocknet und erneut einrotiert. Nach Kristallisation aus Methyl-tert.-butyl-Ether/n-Hexan erhält man 2,6 g (= 39,3 % d.Th.) der illustrierten Verbindung vom Schmp. 190° C.

Die folgenden Verbindungen der Tabellen 1, 2 und 3 können in Analogie zu den Beispielen 1, 2 bzw. 3 hergestellt werden.

5			Fp° C														
10			В	r	x	H	CH ₃	снз	C2H5	снз	CH ₃	.	·		x	x	I
15		(Ia)				CH(CH ₃) ₂					Н7	$-(CH_2)_2^-$	-(CH2)4.	-(CH2)-		13)3	сн ₂ сн(сн ₃) ₂
20		, Z	4	H.	СНЗ	CH(C	СНЗ	C2HS	C2HS	C3H2	$i-C_3H_7$				C2H5	C(CH ₃)3	CHSC
25		× ÷	2 _n	T	×	×	I	×	×	Ħ	Ξ	Ξ	H	Ħ	Ŧ	Ŧ	I
30		A H	۲	ួ	CI	Cl	C1	CJ	C1	C	ប	ប	ວ	C	ເວ	ច	CI
35			×	ជ	C	ວ	<u>2</u>	CJ	CI	C	ប	ü	ប	CI	CI	CI	C
40	Tabelle 1		BspNr.	4	ß	9	2	80	6	10	11	12	13	14	15	16	17

6								
10		Fp°C						
15		69	I	= =	I		I	I
20		A	CH CH3	CH2-CH2-S-CH3 CH2-S-CH3	CH2-S-CH2-C6H5	CH2-C6H5 H	z ~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~	CH ₂
25		2n	×	= =	×	H	# .	x
30	(bunz	>-	C1	G G	ច	ច	ប	ບີ
35 '	(Fortset	×	CI	G G	CJ	CJ	CI	CJ -
40	Tabelle 1 (Fortsetzung)	BspNr.	18	19	21	22	23	24

		1																
5		Fp⁰ C								> 230	223					225		
10		æ	H	x	I	æ	I	Ŧ	Ŧ	æ	CH ₃	CH3	c_2H_5	CH ₃	CH ₃	12	4.	5,
15					~			03								-(CH2)2	-(CH2)4.	-(CH ²)2-
20		V	ľ	снз	сн(сн ³) ²	H	CH ₃	CH(CH3)5	I	снз	СНЗ	C2H5	C2H5	C ₃ H ₇	i-C3H7			
25		Zn	6-C1	6-C1	6-C1	x	H	ĸ	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	6-СН3	6-CH3	6-CH ₃	€но-9	6-CH ₃	6-CH ₃
30	(Bunz	*	×	H	Ħ	СНЗ	CH ₃	снз	СНЗ	СНЗ	CH ₃	СНЗ	CH ₃	СНЭ	CH ₃	СНЭ	СНЗ	СНЭ
35	Tabelle 1 (Fortsetzung)	×	CI	CI	ប	CH3	СНЗ	CH ₃	СНЗ	CH3	CH3	СНЭ	CH ₃	СНЗ	СНЗ	СНЗ	CH3	CH3
	119 1 (-Nr.																
40	Tabe]	BspNr.	25	26	27	28	29	30	31	32	33	34	32	36	37	38	39	40

EP 0 456 063 A2

		1										
5												
10		Fp° C			> 220							
		В	H	H	x	x	x	H	Ħ		×	#
20		А	C2H5	C(CH ₃) ₃	H.	CH CH ₃	CH2-CH2-S-CH3	CH2-S-CH3	CH2-S-CH2-C6H5	CH2-C6H5	H Z Z HO	CH ₂
25		Zn	6-CH ₃	6-CH3	6-CH3	9-СН3	6-CH ₃	6-CH3	6-CH3	6-CH3	6-CH ₃	6-CH ₃
30	(Buna	> -	снз	CH3	снз	снз	СНЗ	CH3	СНЗ	CH3	снз	СНЗ
35	Tabelle 1 (Fortsetzung)	×	СНЗ	CH3	CH ₃	снз	CH3	CH3	СНЗ	CH3	CH ₃	СНЗ
40	Tabelle 1	BspNr.	41	42	43	4	45	46	47	48	64	20

		İ											
5		Fp°C							-E	13)2	.H2-	-c(cH ₃) ₂	3H ₂) ₈ -
10		R1	снз	снз	C(CH ₃) ₃	CH ₃	(сн ³) ⁵ сн.	-э ^є (Енэ)	$cH_3-(cH_2)_3-$	C2H5-C(CH3)2	- ² но-о ^E (Eно)	(сн ³) ² сн-с(сн ³⁾ ²	CH ₂ =CH-(CH ₂)8-
15	(Ib)					m	m	m	m	m	m	m	m
20		В	Ħ	H	x	CH	CH	CH3	CH	CH3	СНЗ	СНЗ	СНЗ
25	* \frac{1}{2} \fra	4	I	CH3	CH3	CH3	CH3	CH3	CH3	снэ	СНЭ	CH3	CH ₃
		$_{\rm n}^{\rm z}$	Ħ	×	×	×	Ħ	×	×	x	Ħ	Ħ	x
30	E B E E	>	C1	ប	ជ	CJ	CJ	ເວ	ប	CI	CJ	C1	ဌ
35		×	CI	ប	CI	ដ	ប	ប	CI	C	C	C1	ຕ
40	Tabelle 2	BspNr.	51	52	53	54	55	56	57	28	59	09	61

EP 0 456 063 A2

	-	Fp°C						
5								
10			C1 CH3	C4H9-CH-C2H5	cı CH ₃	H3CCH3	-0-CH3	J.
15		R1	I	O.		н ₃ с-о	н ₃ с-о-	н н 3с
20		В	СНЗ	CH ₃	CH ₃	снз	CH ₃	СНЗ
25		K	СНЗ	снз	CH ₃	СНЗ	CH ₃	CH ₃
		Zn	. 	×	#	æ	æ	I
30	tzung)	*	C1	G	C1	C	C	CI
35	(Fortsetzung)	×	C1	CJ.	CI	CJ	5	. 13
40	Tabelle 2	BspNr.	62	ღ 9	64	65	99	29

EP 0 456 063 A2

5		Fp ^o C						
10			н ₃ с-s-сн ₂ -	CCH ₃	$\sum_{c_2 H_5}$	OCH ₃	.e.	
15		R1	H ³ C-	٩^٩	۹ [^] ۰		OCH3	H ₃ co—
20		В	CH3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	снз
25		4	снз	снз	CH ₃	CH ₃	CH ₃	СН3
		$_{\rm n}^{\rm z}$	æ	Ħ	x	æ	x	I
30	tzung)	> -	CJ	C1	CI	CI	ច	C1
35	Fortse	×	C1	ច	C1	G	, <mark>5</mark>	. 5
40	Tabelle 2 (Fortsetzung)	BspNr.	89	69	20	7.1	22	73

EP 0 456 063 A2

		اں					
5		Fp⁰ C					
10			CH ₃	GH ₃		NO ₂	No ₂
15		R1			H ₃ C	-	
20		æ	CH ₃	CH ₃	в сн3	CH ₃	CH ₃
25		₹	CH3	CH ₃	CH ³	CH ₃	CH ₃
30	ng)	Y 2 _n	TO	С1	С1	С1	С1 Н
35	Tabelle 2 (Fortsetzung)	×	ជ	5	C1	CI	C1
40	belle 2	BspNr.	74	75	92	2.2	78
45	Ta	Be					

EP 0 456 063 A2

5		Fp⁰ C					
10			\downarrow	5			
15		R1	N ² O		V 5	C1	
20		В	СНЗ	СНЗ	снз	CH ³	СНЗ
25		Ą	снз	снз	CH3	CH3	снз
30		2 _n	Ħ	I	Ħ	æ	æ
	tzung)	*	5	CI	C1	ច	ច
35	<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)	×	CJ	G	CI	5	C1
40	119 2	BspNr.				A3 '	
45	Tabe	Bsp.	62	80	81	80	83

EP 0 456 063 A2

		Fp° C										
5									13)2	i m		
10				CH-	-5	H2)3-	C2H5-C(CH3)2	- ² нэ-э ^е (енэ)	(сн ³) ⁵ сн-с(сн ³) ⁵	CH ₂ =CH-(CH ₂) ₈ -	CH ₃	C4H9-CH-C2H5
15		R1	CH ₂	(CH ₃) ₂	-2 ^E (CH ²)	сн ³ -(сн ²) ³ -	C2H5-C	(CH ₃)3	(CH ³) ⁵	CH2=CH	C1 H ₃ C	C4H9-C
20		В	CH3	CH3	CH3	снз	снз	снз	снз	CH3	СНЗ	снэ
25		A	CoHe	C ₂ H ₅	C2H5	C2HS	C2H5	C2H5	C ₂ H ₅	C2H5	C ₂ H ₅	C2H5
30		2 ⁿ	I	Ħ	x	x	r	x	r	Ħ	x	r
.0	(gunz	-	C	ເວ	ដ	CI	ទ	ເາ	CI	ເ1	CJ	CI
35	<u> Tabelle 2</u> (Fortsetzung)	×	CI	CI	C	ច	ជ	C	CJ	C	CJ	
40	18.2 (I	Nr.										
45	Tabel	BspNr.	84	88	98	87	88	89	90	91	8	93

EP 0 456 063 A2

19 04	\$ Tabelle 2 (Fortsetzung)	tzung)	30	25	20	15	10	5
- 1	×	*	2 _n	4	æ	R1		Fp° C
	CJ	ü	T.	C2H5	СНЭ		СНЗ	
	G	C1	æ	C2H5	СНЗ	н ₃ с-о	СН3	
	C1	ប៊	æ	C2H5	СНЗ	H ₃ C-0-	, cH ₃	•
	C1	ជ	×	C ₂ H ₅	снэ	H ₃ C		
	CJ	ជ	×	C2H5	снз	H ₃ C-S-CH ₂ -	2H2-	
	ប៊	ü	ĸ	C2H5	CH ₃		CH3	
•	C	ប	Ħ	C2H5	снз		. c2H5	
	5	C	æ	SH20	снз	en de la company	Ē.	

		Fp° C						
5								
10			\downarrow		CH ₃			NOS
15		R1	ОСНЗ	H ₃ co—		E L	Н3С	
20		æ	CH ₃	снэ	снз	CH3	снэ нэс	CH3
25			C2H5	C2H5	C2HS	C2HS	C2H5	C2H5
30		2 _n	×	Ħ	×	Ħ		ж
35	tzung)	¥		G	CJ	C1	CI	C1
	(Fortsetzung)	×	CJ	CI	C1	C1	CI	C1
40	~]	-Nr.						
45	Tabelle	BspNr.	102	103	104	105	106	107

50 ·

ţ

EP 0 456 063 A2

		Fp° C						
5		<u></u>						
10			1	1	5 人	1	1	<
15		R1	NO2	OZN				
20		В	СНЗ	CH3 OSN	снз	снз	снз	СНЭ
25		A	C2H5	C2H5	C2HS	c ₂ Hs	c ₂ H ₅	C2H5
30	2	2 _n	æ	I	I	×	×	Ħ
35	etzung	*	ຕ	C3	C1	ប៊	CI	C1
	(Forts	×	ប៊	Cl	ü	CI	C1	CJ
40	Tabelle 2 (Fortsetzung)	BspNr.						
45	Tabe	Ввр	108	109	110	111	112	113

EP 0 456 063 A2

5		Fp° C										
10						-E	13)2	CH2-	-с(сн ₃₎₂	CH ₂)8-	, ch ₃	C2H5
15	·	R1	CH	(CH ₃) ₂ CH-	сн ³) ³ с-	$CH_3 - (CH_2)_3 -$	C2H5-C(CH3)2	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	(сн ³) ⁵ сн-с(сн ³) ⁵	сн ₂ =сн-(сн ₂)в-	C1	C4H9-CH-C2HS
20		B	H H	C ₂ H ₅	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	C ₂ H ₅	C2H5
25		Ą	# 0	C2HS	c_2H_5	C2HS	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5
30		$_{\rm n}^{\rm z}$	I	: #	Ξ	Ħ	×	Ħ	×	×	x	I
	(gunz	>-	5	; ដ	ເວ	ប	CJ	ប៊	ü	5	Ü	ប
35	<u> Tabelle 2</u> (Fortsetzung)	×	5	រី ប៊	ເວ	CJ	ប	CJ	CI	ច	Cl	C1
40	1e 2 (F	. r.										
45	Tabel	BspNr.		115	116	117	118	119	120	121	122	123

EP 0 456 063 A2

5		Fp° C							
10			CH ₃	CH ₃	CH ₃		- 2	CH ₃	C ₂ H ₅
15		R1	610	H ₃ C-0	н ³ с-о	H ₃ C	H3C-S-CH2-		
20		æ	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	c ₂ H ₅	C2HS
25		K	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5
30		$^{2}_{n}$	æ	Ħ	Ħ	· *	I	æ	x
	zung)	٨	ជ	CI	CJ	ច	ប៊	ច	CI
35	ortset	×	បី	បី	CI	ដ	ບ	c ₁	C
40	Tabelle 2 (Fortsetzung)	BspNr.	_						_
45	Tabe	Ввр	124	125	126	127	128	129	130

EP 0 456 063 A2

5		Fp° C						
10			осн3	1		СН3	1	
15		R1		ОСНЗ	H ₃ CO		CH3	н3с
20		æ	C2HS	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5
26		A	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5
30		2n	æ	æ	×	æ	ж	x
	(gunz	>-	CI	c ₁	ü	ដ	CI	CJ
35	(Fortsetzung)	×	ច	C1	CJ	. បី	ច	CI
40	~	Nr.			·			
45	Tabelle	BspNr.	131	132	133	134	135	136

		Fp° C							
5									
10			NO2	Nos		\vec{c}			
15		R1			024		~ 5	C1	~
20		В	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5
25		«	C2HS	C2H5	C2HS	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5
30		2 _n	Ξ	æ	×	Ξ	I	×	æ
	(sang	>-	CI	CI	ប៊	CJ	ច	បី	CJ
35	(Fortsetzung)	×	C1	ប៊	CI	. 13	C	Cl	
40	Tabelle 2	BspNr.	137	138	139	140	141	142	143

5		Fp°C										
10				, 2 ^{CH-}	-ɔ ^ɛ ($cH_3 - (cH_2)_3 -$	C2H5-C(CH3)2	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	(сн ³) ² сн-с(сн ³) ²	CH ₂ =CH-(CH ₂)8-	$^{\text{Cl}}$	C4H9-CH-C2H5
15		R1	СНЗ	(CH ₃)	(CH ₃)	CH3-	C2H5.	(CH ₃	(CH ₃	CH ₂ =(υ π π	C4H9
20		a	CH3	снз	снз	CH ₃	снз	снэ	снэ	снз	CH ₃	CH ₃
25		A	C3H2	c_{3H_7}	C3H2	C3H2	C3H7	C3H2	C ₃ H ₇	C3H2	C3H2	C ₃ H ₇
30		2 _n	×	Ħ	Ξ	H	I	ж	×	Ħ	æ	I
	(guna	>	CJ	ច	ជ	CJ	ប៊	CI	CJ	CI	CI	CJ
35	Tabelle 2 (Fortsetzung)	×	C	CI	Cl	CJ	ບ	CJ	ប៊	c ₁	ប៊	CJ
40	116 2 (-Nr.										_
45	Tabe	BspNr.	144	145	146	147	148	149	150	151	152	153

EP 0 456 063 A2

5		Fp⁰ C								
10			\times	× cH ₃	× cH ₃	(сн2-	\times	$\times_{c_2 H_5}$	OCH ₃
15		R1	- 13	H ³ C-0-	н ₃ с-о-	H ₃ C	H3C-S-CH2-	 	 	
20		æ	СНЗ	снз	снэ	CH ₃	снз	снэ	снэ	CH ₃
25		4	C3H7	C ₃ H ₇	C3H2	C ₃ H ₇	C ₃ H ₇	C ₃ H ₇	C3H2	C ₃ H ₇
30		2 _n	æ	Ħ	Ħ	Ħ	Ħ	æ	Ħ	· ж
	(gunz	>-	ប	ເາ	CI	G	CI	CJ	CI	ច
35	(Fortset	×	5	CI	CI	C1	បី	ច	C1	CI
40	Tabelle 2 (Fortsetzung)	BspNr.	154	155	156	157	158	159	160	161

		Fp° C							
5									
10		R¹	OCH3	H ₃ co	CH ₃	CH ₃	H_3c	ZON	Z _{ON}
. 20		В	CH3	CH ₃	CH ₃	снз	СНЗ	снз	CH ₃
		4	c ₃ H ₂	C3H7	C3H2	. C ₃ H ₇	C ₃ H ₇	C3H2	C ₃ H ₇
25		2 _n	×	I	x	· #	æ	ᇁ	ж
30	(gunz	۶	CJ	CJ	CI	C1	C]	ច	C1
35	(Fortsetzung)	×	CJ	ច	CJ	C	្រ	CI	. 01
40	rabelle 2 (BspNr.	162	163	164	165	166	167	168

EP 0 456 063 A2

5		Fp° C										
10		R1		<u>5</u>		\Diamond		снз	(CH ₃) ₂ CH-	(CH ₃) _{3C} -	$CH_3 - (CH_2)_3 -$	C2H5-C(CH3)2
15	٠	a	20			_C1_						
20		æ	CH ₃	CH3	CH ₃	CH ₃	cH ₃		СНЭ	СНЭ	снэ	СНЗ
25		۷	C3H2	C3H2	C ₃ H ₇	c ₃ H ₇	C3H2	i-C3H7	i-C3H7	i-C3H7	i-C ₃ H ₇	i -c3H7
		2 _n	æ	æ	x	×	æ	x	I	x	æ	H
30	(Bunz	> -	CJ	C1	ជ	G	ប	ប	CJ	C1	C	ប៊
35	(Fortsetzung)	×	CJ	ü	បី	CI	បី	ប	CI	CJ	CJ	C
40	Tabelle 2 (BspNr.	169	170	171	172	173	174	175	176	177	178

EP 0 456-063 A2

		Fp° C									
5				2,6							
10		R1	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	(сн ³) ⁵ сн-с(сн ³) ⁵	СН ₂ =СН- (СН ₂) в-	C1 CH3	C4H9-CH-C2H5	c1 CH ₃	^{Н3С-0}	H ₃ C-0—X	
15									H H	E H	H ³ C
00		æ	снз	снэ	снэ	снэ	снэ	снз	снэ	СНЭ	снз
20		A	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	i -C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	i-C3H7	i-C3H7	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇
25											
		2 _n	I	Ħ	×	x	=	æ	æ	æ	Ħ
30	(gunz	>-	CI	G	C	G	ដ	ប	.	ជ	ü
35	Fortset	×	C	C1	C1	ដ	ច	ប៊	ប	C1	C1
40	Tabelle 2 (Fortsetzung)	BspNr.	179	180	181	182	183	184	185	186	. 187

EP 0 456 063 A2

5		Fp ^o C				·				
10		አ1	н ₃ с-s-сн ₂ -	CCH ₃	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	H ₃ CO	CH ₃	e C
		Ø	снз	снэ	снз	снз	снэ	снз	снэ	CH ₃
20		٧	i-C3H7	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	i-C3H7	i-C3H7	i-C3H7	i-C ₃ H ₇	i-C3H7
25		Zn		_	_					
		. 7	н	.	Ξ	Ħ	I	H	×	I
30	(gunz	Y	CI	CI	CI	CI	CI	C1	CI	CI
35	(Fortsetzung)	×	C1	C1	ເວ	CI	CI	បី	CI	
40	Tabelle 2	BspNr.	188	189	190	191	192	193	194	195

EP 0 456 063 A2

5		Fp⁰ C					·		
10				Z NO Z	C C C C C C C C C C C C C C C C C C C		i d		
15		n.	н3с-	~	~ Z	OZN	~	⋄ 8	C1 \
20		Д	снз	снз	снз	CH ₃	снз	СНЗ	CH ₃
		4	i-C ₃ H ₇ CH ₃	i-C ₃ H ₇	i -C3H7	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	i-C3H7	i-C3H7
25		zn	r	r	x	×	x	x	I
30	(gunz	> -	CI	5	C	C1	C	បី	CJ
35	(Fortsetzung)	×	CJ	C1	C C	CI	C1	C1	C1
40	Tabelle 2 (1	BspNr.	196	197	198	199	200	201	202

EP 0 456 063 A2

		Fp° C											
5		£.								3,2			
10				снз	H3)2CH-	(сн ³) ³ С-	сн ₃ -(сн ₂) ₃ -	C2H5-C(CH3)2	(CH3)3C-CH2-	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂	сн ₂ =сн-(сн ₂) _в -	c1 H3c CH3	C4H9-CH-C2H5
15		R1		່ວ	S	9	່ວ	ິວັ	9	5	່ວ	144	ບ້
20		æ	-c ₃ H ₇ CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	H ₂)4-	-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂)4-	-(CH ₂)4-	-(CH ₂)4-	-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂) ₄ -
25		V.	 D	0) 1) -) -	- (۵	ວ) -	- (د	٥) -	٥)-	٠ (د	5)-
		zn	×	Ħ	H	H	×	Ħ	×	I	×	#	I
30	(guna	> -	C1	ប	C1	CI	CJ	C1	CI	ü	ប	C1	CI
35	ortsetz	×	CI	CI	ü	CI	ដ	CJ	cı	ប	ប	ប៊	CJ
40	<u> Tabelle 2</u> (Fortsetzung)	BspNr.	203	204	205	206	202	208	509	210	211	212	213

EP 0 456 063 A2

5		Fp ^o C							
10			\times	CH ₃	[€] CH ³		H2 -	× CH3	C ₂ H ₅
15		R1		H ₃ C-0	H3C-0-	H ₃ C	н3с-ѕ-сн2-		
20		æ	-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂)4-	-(CH ₂)4-	-(CH ₂)4-	-(CH ₂)4-	-(CH ₂) ₄ -
25		A	5) -	i) -	: (C	10) -	- (CF	ť) ·	Ö) -
30	•	2 _n	x	æ	x	_ =	×	=	Ħ
35	etzung	> -	CJ	C1	CJ	C1	ເງ	C	CJ
	Fortse	×	CJ	CI		C1	CI	ິບ	ເວ
40	Tabelle 2 (Fortsetzung)	-Nr.							
45	Tabe	BspNr.		. 215	216	217	218	219	220

EP 0 456 063 A2

5		Fp°C						
10			еноо 🗸	. 人	\downarrow	снэ 🙏	\downarrow	人
15		R1		OCH ₃	H ₃ co		CH ₃	H ₃ c
20 25		A B	-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂)4-	-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂) ₄ -
30		Z _n	ж	x	æ	æ	æ	x
35	tsetzung)	×	C1 C1	c1 c1	C1 C1	C1 C1	C1 C1	C1 C1
40	Tabelle 2 (Fortsetzung)	BspNr.						
45	Tabe	Bap	221	222	223	224	225	226

5		Fp° C			·				
10			NO ₂	Ţ	Ţ	5 人	Ţ	<u> </u>	<u> </u>
15		R1		Noz	OZNZO			CID	
20		æ	-(CH ²) ⁴ -	-(CH ₂) ₄ -	(CH ₂)4-	-(CH ₂) ₄ -			
25 30	·	Z _n A	ı x	Ħ	ï m	æ	æ	H	ı m
35	tzung)	*	C C	CI	CJ	C1	CI	ដ	CJ
40	(Fortse	×	CJ	CJ	CJ	C1	C1	ច	
45	<u> Tabelle 2</u> (Fortsetzung)	Bsp. "Nr.	227	8228	525	230	231	232	233

50

- 55

EP 0 456 063 A2

5		Fp° C							2							
10			-100	-500	CH3-(CH2)3-	С ₂ H ₅ -с(СН3) ₂	-	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂	-	сн ₂ =сн-(сн ₂)в-	>	\nearrow_{cH_3}	C4H9-CH-C2H5	· -	CH ₃
15		R1	CH3		CH3	C2H5		(CH ₃	(сн3		CH ₂ =	นี	H ₃ C-	C4H9	6	5 5
20		Ф	2)5-) 2 () 3 (2) s 2) s	2)2-		2)2-	2)5-		2)5-		2)5-	2)5-		-5(2
25		¥	HO -		-(CH ₂)	-(CH ₂) ₅ -		-(CH2)2-	-(CH ₂) ₅ -		-(CH ₂) ₅ -		-(CH ²)2-	-(CH ₂)2-		-(CH ²) ² -
30		2n	= :	: ::	Ξ	Ħ		×	×		æ		I	Ξ		×
35	(sand	> -	ច	3 5	ដី	CI		C	ប		ប		CI	CI		CI
30	ortse	×	ដ	3 5	ច	CI		CI	C		CI		បី	C		CI
40	Tabelle 2 (Fortsetzung)	<u>.</u>														
4 5	Tabell	BspNr.	234	2.55 2.55 2.55 2.55 2.55 2.55 2.55 2.55	237	238		239	240		241		242	243		244

\$ \$ \$ \$ \$ \$ Zabelle 2 (Fortsetzung)	6 (Fortset	t zung)	30	25	20	15	10	5
BspNr.	×	>	2 ⁿ	4	ф	R1		Fp° C
245	G	CI	x	-(CH ₂) ₅ -	l Io	н ₃ с-о	сн3	
246	CI	ü	×	-(CH ₂) ₅ -	- I	H ₃ C-0	СНЗ	
247	CI	C1	×	-(CH ₂) ₅ -	l VO	H ₃ C		
248	C	ជ	. #	-(CH ²) ² -		н ³ с-s-сн ⁵ -	١,	
249	CJ	ü	I	-(C ₂ H ₂)5	5		, CH ₃	
250	G	CJ	Ħ	-(CH ₂) ₅ -	i G		C2H5	
251	C1	G	Ħ	-(CH ₂) ₅ -	l _s		OCH ₃	

EP 0 456 063 A2

40	35	30		20 25	10	5
abelle 2 ((Fortsetzung)	(gunz				
SapNr.	×	*	$^{2}_{n}$	A B	R ¹	Fp° C
252	C1	C1	ж	-(CH ₂) ₅ -	OCH ₃	
253	បី	ប	Ħ	-(CH ₂) ₅ -	H3co	
254	ü	ច	x	. (CH ₂)5-	CH ₃	
255	CI	CJ	I	-(CH ₂) ₅ -	E S	
256	C	CI	I	-(CH ₂) ₅ -	H_3c	
257	CJ	C1	æ	-(CH ₂) ₅ -	NO2	
258		CI	r	- (CH ²) ² -	NOS	

_		Fp° C											
5													
10			\downarrow	ī <u></u>		\downarrow			3)3		3)3		3)3
15		R1	NZO			C1		CH3	C(CH ₃) ₃	СНЗ	CCH	CH ₃	C(CH
20		B	-(CH ₂) ₅ -	-(CH ₂)s-	H	Ξ	Ξ	Ξ	×	H			
25		4	- (CI	: :	- (د	5) -) -	H		L CH ₃		Ħ	H
30		Zn	×	x	x	I	Ħ	(P-C1	6-01	6-C1	6-C1	I	H
	tzung)	۶	CJ	CI	C1	Cl	CI	I	I	I	I	СНЭ	
35	(Fortsetzung)	×	C1	ij	បូ	CI	C1	ច	CJ.	ច	CJ	CH3	CH ₃
40	Tabelle 2	BspNr.	259	. 260	261	. 292	563	264	265	266	267	892	569

EP 0 456 063 A2

5		Fp⁰ C							H ₃					132		152
10				с(сн3)3		CH(CH ₃) ₂	H ₃) ₃	H3)2CH2C1	H3)2CH2-0-CI	CH2-S-CH3	CH ₃				сн(сн ³) ₂	с(снз)з
15		R1	CH3	0)0	снз	CHC	0)0	0)0	0)0	CH2	° ^٩		\	снэ	CHC	0)0
20		Œ	Ħ	x	Ħ	Ξ	H	I	H	H	Ξ	æ	H .	Ξ	Ξ	x
25		4	CH3	СНЗ	x	I	=	Ħ	=	Ħ	I	x	×		СНЗ	
		2 _n	Ħ	H	6-СН ₃	6-CH3	6-CH3	6-CH3	6-CH3	6-СН3	€но-9	е-сн ³	6-СН3	6-сн3	6-CH ₃	6-CH ₃
30	(Bunz	*	CH3	CH3	СНЭ	СНЗ	СНЗ	снз	снз	снз	снз	CH3	снз	CH ₃	СНЭ	снз
35	(Fortsetzung)	×	CH3	снз	CH ₃	СНЭ	CH3	CH3	CH3	снз	снз	снз	СНЭ	снз	CH3	снз
40	Tabelle 2	BspNr.	270	271	272	273	274	275	276	277	278	279	280	281	282	283

EP 0 456 063 A2

		Fp°C						·	188		213		CH ₃	
			C(CH ₃) ₂ CH ₂ C1	с(сн ₃) ₂ сн ₂ -0-сн ₃	сн ₂ -s-сн ₃	× _{CH3}			снз	сн(сн ³) ²	(сн ³) ³	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C1	с(сн ₃) ₂ сн ₂ -0-сн ₃	сн2-s-сн3
		R1	C(CH	C(CH	CH2-			<	2	2	Ü	Ü	C	ច
		æ	Ħ	H	Ħ	x	E	æ	1)2 Н	1)2 н	1)2 H	1)2 H	1)2 H	1)2 H
		4	снз	CH ₃	снз	снз	снэ	снз	CH(CH3)5	сн(сн3)5	CH(CH ₃) ₂	сн(сн ³) ²	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂
		2 _n	6-CH3	6-CH ₃	6-CH3	6-CH ₃	€ −СН3	6-CH ₃	6-CH3	6-CH3	6-CH3	6-CH3	6-CH3	6-CH ₃
	(gunz	>	снз	снз	СНЗ	снз	СНЗ	CH3	СНЗ	CH3	СНЗ	снз	СНЗ	снз
	ortset	×	снз	CH3	СНЗ	снз	снз	CH3	СНЗ	СНЭ	снз	снз	снз	снз
	<u> Tabells 2</u> (Fortsetzung)	Nr.												
5	Tabel	BspNr.	284	285	286	287	28 88	588	290	291	262	. 293	294	295

		1			·								
5		Fp				169				m			
10			CH ₃		\bigcirc			H3)2	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C1	c(cH ₃) ₂ CH ₂ -0-CH ₃	CH2-S-CH3	× cH ₃	i i
15		R1	\ 		\	CH3	C2HS	CH(CH3)5	C(CH	C(CH	CH2-	_	
20		B	x	×	x	Ħ	X	H	Ξ	H	Ħ	x	_ =
25		У	6-сн ₃ сн(сн ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	сн2сн(сн3)2	CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
30		z_n	6-CH ₃	6-сн3	6-CH ₃	€-сн3	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH3	€-сн3	6-снз	6-CH ₃
35	(Bun	,	снз	CH ₃	снз	снз	CH3	CH3	снз	СНЗ	СНЭ	снэ	снз
40	(Fortsetz	×	CH3	СНЗ	CH ₃	ck3	CH3	снэ	CH3	CH3	CH ₃	снз	CH3
45	Tabelle 2 (Fortsetzung)	BspNr.	. 296	297	298	599	300	301	302	303	304	305	306

5		Fp		184				m	
10					13,2	3 ₎ 3	C(CH ₃) ₂ CH ₂ C1	с(снз)2сн2-0-сн3	CH ₂ -S-CH ₃
15		R1	<	СНЗ	CH(CH3)5	C(CH3)3	HD) D	с(сн	CH2-
20		ш	I	æ	×	x	I	=	x
25		A	CH2CH(CH3)2	CH ₃	CH C2H5	CH ² CH ₃	CH C2H5	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
30		z _n	6-сн3	6-CH ₃	€но-9	€-сн³	6-CH ₃	€-сн³	6-снз
35	(Buna	Y	СНЗ	снз	CH ₃	снз	снз	снз	СНЗ
40	(Fortset:	×	снз	снз	СНЭ	снэ	CH3	снз	CH3
45	Tabelle 2 (Fortsetzung)	BspNr.	307	308	309	310	311	312	313

EP 0 456 063 A2

	Fp°							ī		
5	E								o-ch ₃	
10		CH ₃	i i			13,2	3,5	$c(ch_3)_2ch_2c_1$	с(сн3)2сн2-0-сн3	CH2-S-CH3
15	R1			\	СНЭ	CH(CH ³) ⁵	C(CH ₃) ₂	C(CH ₂	C(CH ₂	CH2-8
20	В	н	x	# ·	I	Ħ	I	I	I	ĸ
25	۷	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	6-снз -(СН2) ₂ SCH3	6-CH3 - (CH2)2SCH3	6-СН3 - (СН2)28СН3	6-сн ₃ -(сн ₂) ₂ scн ₃	6-снз -(сн2)25сн3	6-CH3 - (CH2)2SCH3
30	2 _n	€н2-9	€н2-9	6-сн3	6-CH3	6-CH3	6-CH3	6-CH3	6-CH3	6-CH3
35	zung) Y	снз	снэ	CH ₃	снз	СНЭ	CH3	СНЭ	снз	снз
40	(Fortset	CH3	снз	СНЗ	СНЗ	СНЭ	СНЭ	CH3	CH3	СНЗ
45	Tabelle 2 (Fortsetzung) BspNr. X Y	314	315	316	317	318	319	320	321	322

EP 0 456 063 A2

5 ·		Fpº				94	95	216		230		183	175	
10			CH3	<u></u>			3		-нэг	- ₂ E	CH3-(CH2)3-	С ₂ Н5-С(СН3)2	(сн ₃)3с-сн ₂ -	(сн3)5сн-с(сн3)5
15	`	R1			〈	СНЗ	-с(сн ³) ³	снэ	(CH ₃)	(CH ₃) ₃ C-	CH3-((C2H5-	(EHO)	(снз)
20		В	щ	ĸ	Ħ			снз	CH ₃	CH3	CH ₃	снз	снз	снз
25		A	6-сн ₃ -(сн ₂) ₂ sсн ₃	6-сн ₃ -(СН ₂) ₂ SCH ₃	6-сн _з -(сн ₂) ₂ scн ₃	-(CH ₂) ₂ -	$-(CH_2)_2^-$	снз	снз	снз	снз	снз	. CH ₃	снэ
30		Zn	6-CH3-	6-CH3-	6-CH3-	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH3		6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃
35	(guna	٨	CH ₃	снз	снз	снз	снэ	снз	CH ₃	СНЗ	снэ	снз	снз	снз
40	(Fortsetzung)	×	снэ	CH3	СНЭ	снз	СНЗ	СНЗ	СНЗ	СНЭ	снз	снэ	снз	снз
45	Tabelle 2	BspNr.	323	324	325	326	327	328	329	330	331	332	333	334

EP 0 456 063 A2

		1								
5		Fр								
10			CH ₂ =CH-(CH ₂) ₈ -	\times	C4H9-CH-C2H5	CH ₃	Sep.	₹ F		н ₃ с-s-сн ₂ -
15		R1	CH2:	C1— H ₃ C—	C4H9-	C] -[]	.э ^Е Н	н ₃ с-0-	H ₃ C	H3C-5
20		æ	CH3	снз	снз	снз	снз	CH ₃	CH3	CH ₃
25										
		V	Енэ	снэ	СНЭ	снэ	снз	снз	снз	снз
30		2 _n	е-сн ^з сн ³	6-сн3	6-СН3	6-СН3	6-сн3	6-CH ₃	6-CH ₃	€но-9
35	(gun	>	снз	снз	снз	снз	снэ	снз	CH3	снз
40	(Fortsetz	×	СНЗ	снз	СНЭ	снз	снз	снз	снз	СНЭ
45	Tabelle 2 (Fortsetzung)	BspNr.	335	336	337	338	338	340	341	342

		I							
5		Fp ⁰							
10.			CH ₃	C2HS	OCH3			CH ₃	
15		R1	P^P	- -		00н3	н ³ со-		3
20		B	снэ	СНЗ	CH ₃	CH3	снз	снз	CH ₃
25									
		4	СНЭ	снэ	CH ₃	снз	СНЗ	снз	снз
30		^{2}n	е-сн ³	6-сн3	6-сн ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	6-СН3
35	(Bunz	¥	снэ	снэ	CH ₃	CH ₃	CH ₃	снэ	СНЗ
40 .	2 (Fortsetzung)	×	СНЭ	СНЗ	CH3	CH3	CH3	CH3	СНЗ
45	Tabelle 2	BapNr.	343	344	345	346	347	348	349

EP 0 456 063 A2

45	40	35	30		25	20	15	10	5
Tabelle 2 (Fortsetzung)	Fortsetz	(gunz							
BapNr.	×	*	2 _n	4		В	R1		Fp ⁰
. 350	CH ₃	СНЭ	6-CH ₃	снз		снз	H ₃ C		
351	снз	СНЗ	6-CH ₃	снз		снэ		NOS	
352	CH3	снз	^Е нэ- 9	снз		. снз	Ş	\downarrow	
353	снз	снз	6-CH ₃	СНЗ		снз	N ² O		
354	CH3	СНЗ	€нэ-9	снз		снз		ī 人	
355	CH ₃	снз	6-CH ₃	снз		снз	[\sigma_z		·
356	снз	снз	ено-9	снз		CH ₃	CI-		

5		Fр										2				
10			\ (снз	3H ₃) ₂ CH-	-э ^е (енэ)	сн ³ -(сн ²) ³ -	2(EH2)2-SH22	-	(сн ³) ³ с-сн ² -	(CH3)2CH-C(CH3)2	•	CH2=CH-(CH2)8-	$\begin{array}{c} c_1 \\ H_3 c \\ \end{array} C H_3$	С ₄ Н9-СН-С ₂ Н5
15		R1			ΰ	٥	3	ប៊	Ü		_	Ξ		ື		ິບ
20		В		снз	СНЗ	СНЭ	СНЭ	СНЗ	снз		снз	снз		снз	СНЗ	CH3
25																
		A		снэ	C2H5	c_2H_5	c_2H_5	c_2H_5	c_2H_5		C2H5	C2HS		c_2H_5	c_2H_5	C2H5
30		^{2}n		6-CH ₃	6-CH3	6-CH3	6-CH ₃	6-CH ₃	6-сн3		€-сн3	€+2-9		6-сн3	6-CH ₃	€-сн3
35	(gunz	¥		снз	CH ₃	снз	СНЭ	СНЗ	CH ₃		снз	CH ₃		снэ	снэ	снз
40	(Fortset	×		снэ	СНЭ	CH3	CH3	СНЭ	СНЗ		СНЗ	СНЗ		снз	снэ	CH3
45	Tabelle 2 (Fortsetzung)	BspNr.		357	358	359	360	361	362		363	364		365	366	367

EP 0 456 063 A2

45	40	35	30	25	20	10	5	
Tabelle 2	(Fortsetzung)	(bunz			,			
BspNr.	×	> -	$^{2}_{n}$	A	В	R1	Fр ^о	1
368	СНЗ	снз	6-CH ₃	C2H5	CH3	C1 CH ₃		
369	CH ₃	снэ	^Е НЭ- 9	C2H5	СНЭ	$\underset{H_3c}{\overset{\text{-o}}{\longrightarrow}} c_{H_3}$		
370	cH ₃	СН3	е-сн ³	C2H5	СНЗ	H ₃ C-0 H ₃ C-0CH ₃		
371	снз	снз	6-CH3	C2H5	CH ₃	H ₃ C		
372	снз	снз	€-сн³	C2H5	CH ₃	H3C-S-CH2-		
373	CH3	снз	ено-9	C2H5	CH ₃	Senson Senson		
374	снз	снз	^Е но-9	C2HS	снз		ູ່ທຸ	
375	CH ₃	CH ₃	6-CH3	C2H5	CH ₃	OCH ₃		

EP 0 456 063 A2

5		Fр							·	
10				$ \wedge $		CH ₃		<u> </u>	NOZ	
15		R1	еноо		H3C0_		E. J.	H ₃ C		
20		В		СНЗ	снэ	снз	CH ₃	CH3	CH3	снэ
25				·ίν	ຸທ	ٍvs	ιρ	ຸທ	ιρ	ຸທ
		4		C ₂ H ₅	C2H5	C2H5	C2HS	C2H5	C2H5	C2H5
30		z_n	•	€н2-9	6-CH3	6-CH ₃	Ено-9	6-CH ₃	6-сн3	6-CH3
35	(gunz	۶.		СНЭ	СНЭ	снз	снз	снз	снэ	снз
40	(Fortsetzung)	×		снз	снэ	СНЗ	CH3	снэ	CH ₃	CH3
45	Tabelle 2	BspNr.		376	37.7	378	37.9	380	381	382

45	40	35	30	25	20	10	5
Tabelle 2 (Fortsetzung)	(Fortset:	(gunz					
BspNr.	×	> -	2 _n	¥	В	R1	Бр ^о
38.3	СНЗ	снэ	6-CH ₃	C ₂ H ₅	снэ	OSN	
						2 2	
384	СНЗ	CH3	€+2-9	C ₂ H ₅	снэ		
385	снэ	снэ	6-CH ₃	C2H5	сн ₃		
						CI.	
386	СНЭ	снэ	6-сн3	C2H5	CH3	CI	
387	CH ₃	CH3	е-сн ³	C2H5	CH3		
388	CH3	снз	€но-9	C2H5	C2H5	снз	
389	CH3	cH_3	€-сн3	C2HS	C2H5	(CH ₃) ₂ CH-	
390	СНЭ	cH_3	6-CH ₃	C2H5	C_2H_5	-э ^є (СНЗ)	
391	снз	СНЭ	6-CH ₃	C2H5	C2H5	CH ³ -(CH ²) ³ -	L_
392	CH ₃	снз	6-CH ₃	C ₂ H ₅	C2H5	C ₂ H ₅ -C(CH ₃) ₂	3,5

EP 0 456 063 A2

		Fpº											
5		E	H2-	2(CH3)		8,2,8	CH ₃	H ₅					
10			(сн ₃) зс-сн ₂ -	(снз)5сн-с(снз)5	. הבלי הבלי	8,2,,,,,,,,,,,2,,8	H ₃ CCF	C4H9-CH-C2H5		£ >	CH3	\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	6
15		R ₁	3	כֿט	č	5	. #	C4.	- CJ	H ₃ C-0-	H ³ C-	H3C-0-	DEH → DEH → DEH
20		В	C2H5	c_2H_5	5	2020	C2HS	C2H5	C2H5		C2#5	C2H5	C2H5
25						10	10	10	10		ιΩ	v	ហ
		×	C2HS	C2HS	:	C2n2	C2H5	c_2H_5	C2H5		C2H5	CZHS	C2H5
30		Zn	6-CH _{3.}	6-CH ₃	į	£ 13-	ено-9	6-сн3	6-CH ₃	į	6-CH ₃	€но-9	EHD-9
35	(bunz	۴	CH3	снэ	į	e E E	снз	снз	CH3	į	CH ₃	снз	CH3
40	(Fortset:	×	CH3	CH ₃	}	CH3	CH ₃	СНЗ	СНЗ		СНЭ	СНЗ	CH ₃
45	Tabelle 2 (Fortsetzung)	BspNr.	393	394		395	966	397	398		399	400	401

EP 0 456 063 A2

5		Fр							
10					NO2	<u></u>		5 	
15		R1	E S	H ₃ C		ON	N20		√\บี บี
20		E3	C2H5	C2H5	C2H5	C2HS	C2H5	. C2HS	C2H5
25			c ₂ H ₅	C2H5	C2H5	C2 ^H 5	C2H5	C2H5	C2H5
30		Z _n A	9-6-СН3	о ^Е но-9	9-сн3	6-сн3 (6-СН3	9-сн3	6-CH ₃ (
35	(gunz	*	снз	снз	снэ	CH ₃	CH ₃	снз	СНЗ
40	(Fortset	×	снз	СНЗ	снз	CH3	CH3	СНЭ	CH3
45	Tabelle 2 (Fortsetzung)	BspNr.	409	410	411	412	413	414	415

55 :

45	40	3 5	30		25	20	15	10	5
Tabelle 2 (Fo	(Fortsetzung)	(gunz							
BspNr.	×	*	Zn	Ą		В	\mathbb{R}^1		Fpo
416	СНЗ	CH3	6-CH ₃	C2H5		C2H5	cı		
417	СНЗ	снз	6-сн3	C2H5		C2H5		〈 :	
418	CH3	снз	6-сн3			снз	CH3		
419	СНЭ	снз	6-CH ₃			снз	(сн ³) ² сн-	CH-	
420	снэ	снз	6-CH3			снз	-э ^є (сн ³) ³ с-	ن	
421	снз	снз	€-сн3	C3H2		снз	сн ³ -(сн ⁵) ³ -	H ₂)3-	
422	снз	снэ	6-сн3	c ₃ H ₇		снз	C2H5-(C2H5-C(CH3)2	
423	СНЗ	СНЗ	€-сн3	C3H2		снз	(CH ₃	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
424	снз	СНЭ	6-CH ₃	C3H2		снз	(снз)	(сн ³) ² сн-с(сн ³) ²	ø
425	снэ	снэ	6-сн3	C3H2		снэ	CH2=Cl	CH2=CH-(CH2)8-	
426	снз	снэ	€ -сн³	СЗН7		снз	H ₃ C –	CCH ₃	

		1							٠	
5		Fp								
10			C4H9-CH-C2H5	× c _{H₃}	× cH ₃	×cH ₃	(-CH ₂ -	CCH ₃	$\nearrow_{c_2 H_5}$
15		R1	C ₄ H	[] []	н ₃ с-о-	H ₃ C-O-	H ₃ C	H3C-S-CH2-	f^ _f	P^P
20		B	снз	снз	CH ₃	снз	СНЗ	CH3	СНЗ	CH3
25			c ₃ H ₇	C ₃ H ₇	c ₃ H ₇	c ₃ H ₂	C ₃ H ₇	C ₃ H ₇	C ₃ H ₂	C ₃ H ₇
30		Z _n A	[©] о ^Е НО-9	50 Eно-9	€-СН3 С3	^г о ^Е но-9	20 Ено-9	Э Ено-9	6-снз с	e-cH ₃
35	(Bun:	>	cH ₃	снэ	снз	снз	CH ₃	снз	снз	снз
40	(Fortsetzung)	×	CH3	СНЗ	снз	CH ₃	CH ₃	снз	снз	CH ₃
45	Tabelle 2	BspNr.	427	428	429	430	431	432	433	434

45	40	35	30	25	20	10	5
Tabelle 2 (Fortsetzung)	(bunz					
BspNr.	×	,	2 _n	Ą	В	R1	Fp ⁰
						CHOO	
435	снз	снз	6-CH ₃	C3H2	СНЗ		
436	СНЭ	снз	6-CH ₃	C ₃ H ₇	СНЭ	осн3	
437	CH3	снз	^Е но-9	C ₃ H ₇	CH ₃	H ₃ CO	
438	СНЗ	снз	6-CH ₃	C3H2	CH3	GH ₃	
439	СНЗ	снз	6-CH3	C ₃ H ₂	CH3	CH ₃	
440	снз	снз	6-CH ₃	C ₃ H ₇	CH3	H ₃ C	
441	СНЗ	снз	6-CH ₃	C3H2	CH ₃	NO Z	

n .
CH3 CH3 CH3 CH3

EP 0 456 063 A2

5		Fpo									
10		R1	С2H5-С(СН3)2	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	(сн ³) ⁵ сн-с(сн ³⁾ ⁵	CH2=CH-(CH2)8-	с1 Н ₃ с СН ₃	C4H9-CH-C2H5	C1 CH ₃	H ₃ C-0-	H ₃ C-0 CH ₃
75										x	# #
20		Œ	снз	CH3	снз	снз	снз	снэ	снз	СНЗ	снз
25		A	i-c ₃ H ₇	i-c ₃ H ₇	i -C3H7	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	i-C3H7	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇
30		zn	6-сн3	6-сн3	6-сн3	€но-9	6-снз	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	е-сн ³
35	(gun	> -	снз	CH3	снз	снз	снз	снз	снз	CH ₃	СНЭ
40	(Fortsetzung)	×	СНЗ	снз	CH ₃	СНЗ	снз	снэ	CH3	CH ₃	CH ₃
45	Tabelle 2	BspNr.	452	453	454	455	456	457	458	459	460

.

EP 0 456 063 A2

										•
5	1	Fp						•		
10			ĺ	•	-сн2-		\nearrow $C_{2}H_{5}$	OCH ₃	e.	
15	•	R.	H _{3C}	H ³ C	н ³ с-s-сн ⁵ -	P^p	P^^p		OCH ₃	н3со—
20		æ		снэ	CH ₃	CH ₃	CH3	СНЗ	CH ₃	СНЭ
25		A		i-C ₃ H ₇	i-C3H2	i-C3H7	i-C ₃ H ₇			
30		Zn		€-сн3	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH3	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃
35	(bunz	>		снз	снз	снз	CH ₃	СНЗ	снз	снз
40	(Fortset:	×		снэ	CH ₃	снз	CH3	снз	снз	снз
45	Tabelle 2 (Fortsetzung)	BspNr.		461	462	463	464	465	466	467

EP 0 456 063 A2

. 5	c (Кр				, ·	
10			<u> </u>	人		H ₃ CH ₃) ₂ CH- CH ₃) ₃ C- H ₃ -(CH ₂) ₃ - C ₂ H ₅ -C(CH ₃) ₂ (CH ₃) ₃ C-CH ₂ - (CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂	CH2=CH-(CH2)8-
15	•	R.	, s	C1		$ \begin{array}{c} \text{СН}_{3} \\ \text{(СН}_{3})_{2}\text{СН}^{-} \\ \text{(СН}_{3})_{3}^{\text{C}^{-}} \\ \text{СР}_{3}^{-} \text{(СН}_{2})_{3}^{-} \\ \text{(СН}_{3})_{3}^{\text{C}^{-}} \\ \text{(СН}_{3})_{2}^{\text{C}^{-}} \text{С} \end{array} $	CH2=CF
20		æ	æ	Ħ	H		
25		A	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	-(CH ₂) ₄ - -(CH ₂) ₄ - -(CH ₂) ₄ - -(CH ₂) ₄ - -(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂) ₄ -
30		Zn	6-CH ₃	Eно-9	6-CH ₃	6-CH3 6-CH3 6-CH3 6-CH3 6-CH3	6-CH ₃
35	(Buna	,	снз	снз	снз	CH ₃ CH ₃ CH ₃ CH ₃ CH ₃	СНЭ
40	(Fortset:	×	СНЗ	CH3	CH ₃	CH3 CH3 CH3 CH3	CH ₃
45	Tabelle 2 (Fortsetzung)	BapNr.	475	476	477	478. 479 481 482 483	485

45	40	35	30	25	20	15	10	5
Tabelle 2	(Fortsetzung)	(gunz						
BspNr.	×	Y	2 _n ,	٨	æ	R1		Fp ⁰
486	снз	снз	6-CH ₃	-(CH ₂)4-	·		ĆH 2	
487	снз	снэ	ено-9	-(CH ₂) ₄ -		-6-CH	-c ₂ H ₅	
488	СНЭ	снз	6-сн3	-(CH ₂)4-		10	CH ₃	
489	снэ	CH3	6-CH3	-(CH ₂) ₄ -		H ₃ C-0-	Ç.	
490	CH3	снз	€-сн³	-(CH ₂)4-		H ₃ C-0-	CH ₃	
491	CH ₃	снз	€СН3	-(CH ₂)4-		н ₃ с Н ₃ с		·
492	CH ₃	CH3	6-сн3	-(CH ₂) ₄ -		н ₃ с-s-сн ₂ -	H2.	
493	CH ₃	снз	6-CH3	-(CH ₂)4-			CH ₃	
494	СНЭ	снэ	6-CH ₃	-(CH ₂) ₄ -			C ₂ H ₅	

EP 0 456 063 A2

45	40	35	30	25	15	10	5
Tabelle 2 (Fortsetzung)	(Fortsetz	(guna	•				
BspNr.	×	¥	Z _n A		B R ¹		Fp ⁰
495	снз	снз	6-CH ₃	-(CH ²) ⁴ -		OCH ₃	
496	СНЭ	снз	6-CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	OCH33	Ţ	
497	CH ₃	снэ	6-сн3	-(CH ²)4-	_{Н3} со		
498	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	5	CH ₃	
499	снз	СНЗ	6-CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	E E	1	
200	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	-(CH ₂)4-	H_3c	ſ	٠
501	снз	CH ₃	6-СН3	-(CH ₂) ₄ -	Z	ZON.	

5		Fpo							
10				1	5 人	1	1	< ·	l m
15	•	R1	NO ₂	O ₂ N ₂ O					сн ₃ (сн ₃) ₂ сн- (сн ₃) ₃ с- сн ₃ -(сн ₂) ₃ -
20		EB :							
25			-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂)4"	-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂)5- -(CH ₂)5- -(CH ₂)5-			
		4							
30		2 _n	6-сн3	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	6-сн3	6-CH ₃ 6-CH ₃ 6-CH ₃
35	(Bunz	Y	СНЗ	CH ₃	снз	СНЗ	cH ₃	снз	CH ₃
40	ortseta	×	снэ	снэ	CH ₃	снз	снз	CH ₃	CH ₃ CH ₃ CH ₃
45	Tabelle 2 (Fortsetzung)	BspNr.	502	503	504	505	909	202	508 509 510 511
_	Tal	Bsi	2(5.6	50	2(5(2(508 509 510 511

50

. 55

45	40	35	30	25	20	15	10	5	
Tabelle 2 (Fortsetzung)	(Fortset:	(Bunz							
BspNr.	×	¥	Z _n A		8	R1		Fp°	
512	CH ₃	СНЗ	6-сн3	-(CH ₂) ₅ -		C2H5-C(CH3)2	2		
513	CH ₃	снэ	6-сн3	-(CH ₂) ₅ -		(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	-2		
514	СНЭ	снз	€-СН3	-(CH ₂) ₅ -		(сн ³) ² сн-с(сн ³⁾ ²	2(CH ₃) ₂		
515	CH ₃	снэ	€н⊃-9	-(CH ₂) ₅ -		CH2=CH-(CH2)8-	-8 -2		
516	СНЭ	снз	€+2-9	-(CH ₂) ₅ -		H ₃ C ₁	CH3		
517	СНЭ	снэ	6-CH ₃	-(CH ₂)5-		C4H9-CH-C2H5	C ₂ H ₅		
518	СНЗ	снз	6-сн3	-(CH ₂) ₅ -			CH ₃		
519	снэ	снз	€ +2−9	-(CH ₂) ₅ -		H ₃ C-0	(H)		
520	СНЗ	снэ	6-сн3	-(CH ₂) ₅ -		H ₃ C-0	CH ₃		

5		Fp ⁰								
10			ĺ	,	н ₃ с-s-сн ₂ -	Z. G. B. G.	C2H5	OCH ₃	-F.	
15		R1	H ³ C	H ₃ C	н3с-≀	₽^₽	₽^^p		OCH ₃	н3со
20		æ		i w	i IO	I	1,00	l 10	1,50	
25				-(CH ₂) ₅ -	-(CH ²) ² -	-(CH ₂) ₅ -	-(CH ²) ² -	-(CH ²) ² -	-(CH ₂) ₅ -	-(CH ₂) ₅ -
•		4				•				
30		$^{2}_{n}$		6-CH ₃	€но-9	ено-9	6 - CH ₃	6-СН3	6-CH ₃	6-сн3
35	(bunz	*		снэ	снз	снз	снэ	СНЗ	СНЗ	снэ
40	(Fortset	×		СНЗ	СНЭ	снэ	снз	снэ	снз	CH3
45	Tabelle 2 (Fortsetzung)	BspNr.		521	522	523	524	. 525	526	527

EP 0 456 063 A2

				•	•			٠
5		Fp						
10			CH ₃			2 NO S		
15		R1		CH3	H ³ C		Non	OZN
20		В		10	1	10	10	10
25			-(CH ₂)-	-(CH ₂) ₅ -	-(CH ₂) ₅ -	-(CH ₂)5-	-(CH ₂) ₅ -	-(CH ₂) ₅ -
30		Z _n A	^Є НЭ-9	е-сн3	6-сн3	6-CH ₃	е-сн ³	6-CH ₃
35	(Bunz	Y	СНЗ	снэ	СНЗ	СНЗ	снз	снз
40	(Fortsetzung)	×	снз	CH3	снз	СНЗ	снз	СНЭ
45	Tabelle 2	BspNr.	528	529	530	531	532	533

EP 0 456 063 A2

		1					
5		Fpo					
10			, cı	人		\downarrow	
15	•	R1	Į		2	C1	
20		В		١.	<u>.</u>	<u>'.</u>	10
25				-(CH ₂) ₅ -			
30		Z _n A		6-сн3	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃
35	(Bunz	>		снз	СНЗ	CH ₃	снэ
40	<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)	×		CH3	СНЗ	снз	СНЗ
45	Tabelle 2	BspNr.		534	ស ស ស	536	537
50							

		Fp° C										\
5			снз		2CH-	2сн-сн2-	CH- CH ₃	- ₂ e	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	\downarrow	>	\ \ \ \
10		R ²	снз	C2HS	(СН ³)	(CH ³)	C2H5-CH- CH3	-э ^є (сн ³) ³ с-	(CH ³)		C2H5O	C2H5O
15		æ	снз	снз	снз	снз	снз	снз	CH ₃	снз	снз	снз
20	(Ic)			_								
25	ት	A	СНЗ	CH3	СНЗ	СНЗ	СНЗ	CH3	СНЗ	снэ	СНЗ	СНЗ
30		Zn	Ξ	Ξ	I	×	x	I	x	×	I	I
35	H B B A A A A A A A A A A A A A A A A A	> -	ដ	ເວ	CI	CJ	CI	C	CJ	G	C	CJ
40		×	C1	ប	CI	CJ	. CI	ເວ	CJ	ច	c ₁	C
45	Tabelle 3	BspNr.	538	539	540	541	542	5.43	544	545	546	547

EP 0 456 063 A2

5 10 15		B R ² Fp ⁰ C	сн3 сн3	сн3 сн3 с2н5-0	сн ₃ сн ₃ (сн ₃) ₂ сн-о сн ₃	сн ₃ с ₃ н ₇ -о-тер	сн ₃ сн ₃ с ₂ н ₅ -о⁄-с ₂ н ₅		J	С ₂ н ₅ сн ₃ (сн ₃) ₂ сн-	CH ₃	С ₂ H ₅ СН ₃ С ₂ H ₅ -СН- СН ₃	C ₂ H ₅ CH ₃ (CH ₃) ₃ C-	
25 30		Z _n A	Ü	H	H H	H	H.	н С2	н С2	н С2	н С2	н	н С2	
35	tzung)	> -	CI	ເວ	ច	CJ	CI	ច	CI	CI	CJ		C1	
40	(Fortse	×	CJ	Cl	បី	ប៊	CI	ច	ប	ដ	C1	CI	C1	
45	Tabelle 3 (Fortsetzung)	BspNr.	548	549	550	551	552	553	554	555	556	557	558	

EP 0 456 063 A2

5		Fp° C			\	· }		£н2	CH ₃	СНЭ	C2H5				.H2-
10		R ²	(\downarrow	C ₂ H ₅ O	C2H50		C2H5-0~	(сн ³) ² сн-0	C3H7-0	C2H5-0	снз	C2H5	(CH ₃) ₂ CH-	(сн ³) ² сн-сн ² -
15															
20		В		снз	снз	снз	снз	снз	CH ₃	СНЗ	CH ₃	C2HS	C_2H_5	C2HS	C2H5
25		Ą		C ₂ H ₅	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	C2HS	C2H5	C2H5	C2H5	C2HS	C ₂ H ₅
1					•										
30		2 _n		H	Ħ	Ħ	x	н	æ	Ħ	Ħ	Ħ	I	H	H
35	G G	> -		C1	C)	CJ	C1	CJ	CJ	C1	C1	ເລ	C1	Cl	C1
	tzun	•								•					
40	(Fortse	×		CI	CJ	CI	C1	CI	ບ	ច	ប៊	c ₁	CJ	C	CI
45	Tabelle 3 (Fortsetzung)	BspNr.		260	561	295	563	564	565	999	267	568	569	570	571

EP 0 456 063 A2

45	40	35	30	20	15	5
Tabelle 3 (Fortsetzung)	(Fortsetzi	(Bur				
BspNr.	×	٨	2 _n	A	æ	R ² Fp ⁰ C
. 225	CJ	13	z	C ₂ H ₅	C2H5	C2H5-CH- CH3
573	CJ	CI	×	C2H5	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₃ C-
574	ដ	C1	Ħ	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -
575	C1	C 1	ж	C2H5	C ₂ H ₅	\Diamond
929	C1	C1	I	C2H5	C2H5	C ₂ H ₅ O
277	បី	CJ	ĸ	C2H5	C2H5	C2H50~0
578	CJ	CI	#	C2H5	C2H5	
579	CJ	C1	×	C2H5	C2H5	C2H5-0~~CH3
580	CJ	C1	æ	C2H5	c ₂ H ₅	(cH ₃) ₂ CH-0~CH ₃
581	CI	C1	Ħ	C ₂ H ₅	C2H5	C3H7-0~CH3
582	G	C1	×	c ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C2H5-0~~C2H5

5		Fp ⁰ C											\		
10		R ²	СНЗ	C2H5	(сн ³) ² сн-	$(CH^3)^2CH^-CH^2$	C2H5-CH-	CH ₃	-э ^Е (ЕНЭ)	- ² но-о ⁸ (Eно)	\Diamond	C ₂ H ₅ O	C ₂ H ₅ O	\Diamond	C2H5-0~CH3
15															
20		В	СНЗ	СНЭ	СНЗ	снз	СНЗ		CH ₃	снз	снэ	снз	снэ	СНЭ	снз
25		A	C3H2	C3H2	C3H2	C3H2	C3H2		C3H7	c_3H_7	C3H2	C ₃ H ₂	C3H2	C3H2	C3H2
30		Zn	×	×	Ħ	I	I		x	Ħ	ĸ	I	Ħ	×	ж
35	(Bunz	۲	CJ	ប	ប	C	ប		CJ	ប	C1	C1	CJ.	C	CI
40	(Fortsetzung)	×	C1	ប	C1	ü	C1		C1	CI	ü	C1	CI	cı	C1
45	Tabelle 3	BspNr.	583	584	585	586	587		588	589	290	591	265	593	594

EP 0 456 063 A2

45	40	35	30	25	15	5
Tabelle 3 (Fortsetzung)	(Fortsetz	(buna				
BspNr.	×	¥	zn	٧	Ф	R ² Fp ⁰ C
595	ü	CI	Ξ.	C3H7	снз	енэ сн-о-сн ³
296	c ₁	CI	Ħ	C3H2	снз	C3H7-0-4H2
597	C1	ü	x	C3H2	СНЗ	C2H5-0~C2H5
598	c1	ເາ	Ħ	i-C ₃ H ₇	снз	CH ₃
669	ច	C1	x	i-C3H2	снэ	C2H5
009	CJ	C	I	i-C3H2	снз	(CH ₃) ₂ CH-
601	C1	CJ	I	i-C ₃ H ₇	снэ	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -
	C1	CI	I	i-C3H7	CH ₃	C2H5-CH- CH3
. 609	5	ເວ	x	i-C ₃ H ₇	CH ₃	-э ^г (сн ³)
604	CI	CJ	ĸ	i -C3H7	снз	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -
509	CI	, G	x	i-C3H7	CH ₃	\Diamond
909	. 1 2	ີ່ວ	x	i-C ₃ H ₇	снз	C ₂ H ₅ O

EP 0 456 063 A2

5 10		R ² Fp ⁰ C	H ₅ 0		C2H5-0-CH3	(сн3) 2сн-о-сн3	C3H7-0~CH3	C2H5-0~C2H5	снз	C2H5	(CH ₃) ₂ CH-	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	с ^{2н} 2-сн-	сн _э
20		Ф	CH3	СНЗ	· CH3	снз	CH ₃	снэ	-(CH ₂)4-	-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂)4-	12,4-	-(CH ₂) ₄ -	
25		<	i-C ₃ H ₇	i -C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	i) -	(C)	- (C	-(CH ₂)4	D) -				
30		Z	#	ж	×	x	æ	x	æ	H	æ	H	I	
35		, gunz.	C1	CI	C1	C	CI	CI	ប	CJ	CI	C1	C1	
40		(Fortset	CI	C1	C1	CJ	C1	CJ	2	CJ	C	C1	C1	
45	,	labelle 3 (Fortsetzung) BspNr. X Y	209	809	609	610	611	612	613	614	615	616	617	
50														

EP 0 456 063 A2

		اں								_		
5		Fp ⁰ C		H2-		\ \	\ ?		CH3	CH ₃	сн3	C2H5
10		R ²	-э ^є (Єнэ)	(сн ³) ³ с-сн ⁵ -		C2H50	C ₂ H ₅ O		C ₂ H ₅ -0	(сн ³) ² сн-0-	C3H2-0	C2H2-0
15												
20		В	-(CH ₂)4-	-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂)4-	-(CH ₂)4-	-(CH ₂)4-	-(CH ₂)4-
25		V										
30		2 _n	×	×	ж	x	x	æ	I	Ħ	ж	Ħ
35	(gunz	Y	CI	CJ	ប៊	CJ	CI	Ü	CJ	CI	CI	CJ
40	(Fortset	×	C1	C1	CJ	ü	C1	CI	CI	C1	CI	C1
4 5	Tabelle 3 (Fortsetzung)	BspNr.	618	619	950	621	622	623	624	625	929	627

5		R ² Fp ⁰ C	снз	C2H ₅	(CH ₃) ₂ CH-	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	C2H5-CH-	c _{H3}	-2 ^E (CH ³)	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	\Diamond	C ₂ H ₅ O	c_{2} H $_{5}$ O \sim O \sim		C2H5-0~CH3
15															
20		B	-(CH ₂) ₅ -	-(CH ₂) ₅ -	-(CH ₂) ₅ -	-(CH ₂) ₅ -	-(CH ₂) ₅ -		-(cH ₂) ₅ -	-(CH ₂) ₅ -	-(CH ₂) ₅ -	-(CH ₂) ₅ -	-(cH ₂) ₅ -	-(CH ₂) ₅ -	-(CH ²) ² -
25		A													
30		2 _n	H	Ħ	Ħ	ĸ	H		Ŧ	H	æ	Ħ	Œ	x	ĸ
3 5	(Bur	٠,	CI	C1	CI	CI	ដ		ច	ដី ្	ប	ເວ	CJ	CI	ប៊
40	3 (Fortsetzung)	×	ເວ	C1,	C1	CI	ü		ເນ	Cl	G 1	CJ	CI	C 1	CJ
45	Tabelle 3	BspNr.	628	629	630	631	2E9	·	633	634	635	989	637	638	629

5 10 15		В R ² Fp ^o C	-(CH ₂) ₅ - (CH ₃) ₂ CH-0 CH ₃	-(CH ₂) ₅ - C ₃ H ₇ -O CH ₃	-(CH ₂) ₅ - C ₂ H ₅ -0 C ₂ H ₅	н сн ₃	н сн ₃	H CH(CH ₃) ₂	H $CH_2C(CH_3)_3$	н сн ₃	н сн ₃	H CH(CH ₃) ₂	$H CH_2C(CH_3)_3$	н сн ₃	H C2H5	н сн(сн ₃) ₂	H CH3
25		V	5) -	٥) -	3) -	I	CH ₃	CH ₃	CH3	I	СНЭ	СНЭ	CH3	X	H	Ħ	π
30		Zn	m	x	I	6-61	6-C1	6-C1	6-C1	Ħ	H	I	I	6-CH3	6-CH3	6-CH ₃	6-CH ₂
35	(Sunz	>-	ច	CJ	ប៊	CJ	CJ	ü	CI	СНЭ	снз	СНЭ	СН _З	CH3	CH ₃	снэ	CH2
40	(Fortsetzung)	×	CJ	CJ	ប៊	CI	C1	C1	C	СНЗ	CH ₃	CH ₃	СН3	CH3	CH3	снэ	СНЭ
45	Tabelle 3	BspNr.	640	641	642	643	644	645	646	647	648	649	650	651	652	653	654

		Fp° C											
10		R ²	CH2-C(CH3)3	(CH ₂) ₂ 0-C ₂ H ₅	\Diamond	\Diamond	снз	C2H5	CH(CH ₃) ₂	CH C2H3	сн ² с(сн ³) ³	(CH ₂) ₂ 0-C ₂ H ₅	\bigcirc
16													
20		В	I	Ξ	Ħ	н	Ħ	Ħ	x	x	x	I	Ħ
25		A	Ħ	H	ı	¤	CH3	СНЭ	СНЗ	СНЭ	СНЗ	снз	СНЗ
30		Zn	€н⊃-9	ено-9	6-сн3	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	е-сн3	€но-9	€но-9	€-сн3
35	(Bun:	>	CH ₃	H C	снз	снз	CH ₃	CH3	снз	снз	снз	снэ	СНЗ
40	(Fortsetzung)	×	СНЭ	СНЭ	снз	снз	СНЗ	снэ	снз	снз	снз	снз	снз
45	Tabelle 3	BspNr.	655	929	259	658	629	099	661	662	699	664	665

		Fp° C										
5								ო	2 ^H 5			
10	(R ²	\Diamond	снз	C ₂ H ₅	CH(CH ³) ²	CH C2Hs	CH ₂ C(CH ₃) ₃	(CH ₂) ₂ 0-C ₂ H ₅		\bigcirc	CH ₃
15												
		æ	Ħ	I	I	Ħ	I	x	Ħ	I	Ξ	= =
20 25		4	снз	сн(сн ³) ⁵	сн(сн ³) ²	CH(CH ₃) ₂	сн(сн ³⁾ 2	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH(CH)2	СН ₂ СН(СН3) ₂ СН ₂ СН(СН3) ₂
30		2 _n	6-СН3	6-CH ₃	€н⊃-9	6-CH ₃	6-СН3	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃
35	ortsetzung)	٠	CH ₃	CH ₃	CH3	снз	CH3	снз	CH ₃	СНЗ	СНЗ	CH3
40		×	снэ	СНЭ	CH3	снз	СНЗ	снз	CH3	снз	снз	CH ₃
45	Tabelle 3 (F	BapNr.	999	299	899	699	029	671	672	673	674	675 676

5		Fp° C								-
10		R ²	сн(сн ³)2	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH C2H5	CH ₂ C(CH ₃) ₃	(CH ₂) ₂ 0-C ₂ H ₅		\bigcirc	CH ₃
15										
20		В	2 H	7 H	7 H	7 H	Z Z	Z Z	E C	н н е
25		A	CH ² CH(CH ³) ²	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	сн ² сн(сн ³⁾ ²	CH2CH(CH3)2	сн ² сн(сн ³) ²	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	сн ₂ сн(сн ³⁾ 2	(CH ₂) ₂ -SCH ₃
30		2 _n	6-CH ₃	€-СН3	6-CH ₃	€+2-9	6-CH ₃	е-сн ³	6-CH ₃	^Е НЭ-9
35	(Sunz	۲	снз	CH ₃	CH ₃	снз	снэ	CH3	CH ₃	CH ₃
40 .	(Fortsetzung)	×	СНЗ	снз	снз	снз	снз	CH ₃	снэ	CH ₃
45 .	Tabelle 3	BspNr.	229	678	629	089	681	. 289	683	684 685

50	4 5	40	35	25 30	20	15	10	5
Tabelle 3 (Fort		setzung)						
BspNr.	×	>	Zn	A	В	R ²		Fp° C
686	снз	снз	6-CH ₃	(сн ₂) ₂ -sсн ₃	æ	CH(CH ₃) ₂	N	
687	снэ	снэ	6-CH3	(CH ₂) ₂ -SCH ₃	×	CH C2H5		
688	СНЗ	снз	6-CH ₃	(CH ₂) ₂ -SCH ₃	н	CH2C(CF	13)3	
689	CH ₃	снз	€-сн3	(сн ₂) ₂ -sсн ₃	н	(CH ₂) ₂ 0-C ₂ H ₅	-c2HS	
069	снз	CH ₃	6-CH ₃	(CH ₂) ₂ -SCH ₃	æ	\bigcirc		
691	CH ₃	снз	^Є но-9	(CH ₂) ₂ -SCH ₃	æ			
692	CH ₃	н	6-CH ₃	снз	снз	CH3		
693	СНЗ	СНЭ	6-CH ₃	СН _З	CH ₃	C2H5	•	140
694	CH ₃	CH3	6-CH ₃	CH ₃	снз	-нэ ² (сн ³)	-H.	161-163
969	снз	СНЭ	6-CH ₃	сн _з	снз	(CH ³) ⁵ C	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
969	СнЗ	снз	6-CH ₃	снз	снэ	С ₂ Н ₅ -СН- СРЭ СНЭ	CH- CH ₃	86

		i										
5		Fp°C		-CH2-		>	>	Ţ	CH ₃	н-о-сн3	Сн ₃	C2H5
10		R ²	-э ^є (Єнэ)	- ² н2-э ^E (Eн2)		C2H50	C2HSO		C2H5-0	(снз) 2сн-0	C3H2-0	C2H5-0
20		Ø	CH3	снз	CH ₃	CH ₃	снз	CH3	CH3	снэ	СНЭ	CH3
25		A	снз	снз	СНЗ	снз	снз	снз	снэ	снз	снэ	снэ
30		Zn	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	e-cH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	6-сн3	6-сн3	^Є НЭ-9
35												۵
40	tzung)	>-	CH3	CH3	CH3	СНЗ	СНЗ	снэ	CH3	CH3	CH3	CH3
	<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)	×	CH3	CH ₃	снз	снз	CH ₃	снз	снз	снз	СНЭ	снэ
45	e11e 3	BspNr.										
50	Tab	Ввр	697	869	669	700	701	702	703	704	705	206

		Fp° C													
5		ĮT,				-2				-21		\	\ \		CH3
10		R ²	снз	C2H5	(CH ₃) ₂ CH-	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	C2H5-CH-	CH ₃	(CH3)3C-	(сн ³) ³ с-сн ⁵ -	\bigcirc	C2H50	C ₂ H ₅ O		C2H5-0
15													•		
20		В	СНЗ	СНЭ	СНЭ	CH ₃	СНЗ		СНЗ	СНЗ	СНЗ	CH3	снэ	СНЗ	CH3
25		٧	C2H5	C ₂ H ₅	C2HS	c_2H_5	C2H2		C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	C ₂ H ₅
30		^{2}n	e-cH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃		[€] НЭ-9	6-CH3	€-СН ³	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	6-сн3
35	(gunz	Y	H	снэ	снз	СНЗ	снз		СНЗ	снз	CH ₃	снэ	снз	снз	снз
40	(Fortsetzung)	×	снз	CH ₃	CH ₃	снз	CH3		снз	снз	СНЗ	CH ₃	снз	снз	снэ
4 5	Tabelle 3 (Fo	BspNr.	707	708	402	710	711		712	713	714	715	716	717	718

EP 0 456 063 A2

5		Fp° C	сн-0~Сн3	CH ₃	C2H5			-H2	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	<u>.</u>	снз	-၁့	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
10		R ²	(сн ³) ⁵ сн-0	C3H2-0	C2H5-0	CH3	c_2H_5	(сн ³) ⁵ сн-	(CH3)5(C2H5-CH-	· ប៊	-э ^є (сн ³) ³ с-	(CH ₃)	
20		8	СНЗ	CH ₃	сн ³	C2H5	c_2H_5	. C2HS	C2H5	C2H5		c_2H_5	C ₂ H ₅	C2H5
25		A	c ₂ H ₅	C2H5	C2H5	C2HS	C2H5	C2H5	C ₂ H ₅	C2HS		C2HS	C ₂ H ₅	C2H5
30		2n	€-сн3	€-сн3	6-сн3	6-CH3	€но-9	6-CH3	6-CH ₃	6-сн3		^Е НЭ-9	6-CH ₃	6-CH ₃
35	(Bunza	٨	СНЭ	снз	снз	×	СНЭ	СНЭ	СНЭ	снз		CH3	CH ₃	снэ
40	3 (Fortsetzung)	×	снэ	CH ₃	снз	СНЗ	CH ₃	снз	снз	снз		CH ₃	снз	снз
45	Tabelle 3	BspNr.	719	720	721	722	723	724	725	726		727	728	729

EP 0 456 063 A2

		ان					£ 13								
5		Fp⁰ C	>	>	,	СН3	CH ₃	СН3	C2H5				-2H2		
10			C ₂ H ₅ 0	C2H50		C2H5-0	онэ ² (снз)	C3H7-0	C2H5-0	CHO	C ₂ H ₅	сн ₃) ₂ сн-	(снз) ² сн-сн ² -	C2H5-CH-	CH3
		R ²				0	9	ບິ	υ,	ี่	ပ်`	. 5	٤	ů,	
15			Ŋ	د	S	S.	ω	Ŋ	Ŋ						
20		В	C2H5	C2HS	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	C2H5	, HD	CH3	СНЭ	CH3	CH3	
25		4	C2H5	C ₂ H ₅	C2HS	C ₂ H _S	C2H5	c ₂ H ₅	C2H5	± 5	C3H2	C ₃ H ₇	C3H2	C ₃ H ₂	
30		z_n	6-сн3	€-СН ³	€н2-9	6-CH ₃	6-сн3	€-сн3	6-CH ₃	70.7	6-CH ₂	6-CH ₃	ено-9	6-сн3	
35 .	(bun:	٨	CH ₃	снз	CH ₃	снз	снз	снэ	снз	3	CH	CH3	снэ	снэ	٠
40	(Fortsetzung)	×	CH3	снэ	CH ₃	снз	снз	снэ	снз	į	CH ₂	CH3	снэ	снз	
45	Tabelle 3	BspNr.	730	731	732	733	734	735	736	t C	738	739	740	741	

EP 0 456 063 A2

		Fp° C					\			€нэ			
5		स		.H2-		>	}		CH ₃	\leftarrow	CH3	C2H5	
			-э ^є (Єнэ)	(сн ³) ³ с-сн ⁵ -		C ₂ H ₅ O	C2H50		\ \ \	(сн _з) ₂ сн-0-	\	\ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \	
10		R ²	CH.	(CH;		C 2.	(2 ₂)		C2H5-0	сн3)	C3H2-0	C2H5-0	снз
15													
		В	снз	CH3	снз	c_2H_5	снз	снз	снз	снз	снз	снз	снз
20													
25		A	C ₃ H ₂	C ₃ H ₇	C ₃ H ₇	C ₃ H ₇	C ₃ H ₂	C ₃ H ₇	C ₃ H ₇	C ₃ H ₇	C ₃ H ₇	C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇
30		2 _n	6-CH3	€-сн3	€но-9	€но-9	€но-9	€ +СН ³	€-сн3	€-сн3	6-сн3	6-сн3	6-СН3
35	(gunz	>	CH3	СНЗ	СНЗ	СНЗ	СНЭ	СНЗ	СНЗ	CH3	CH3	СНЗ	æ
40	(Fortsetzung)		снз	снз	снз	снз	снз	снз	снз	снз	снз	снз	c H 3
	3 (Fo	×	O	O	ь	0	O	О	O,	O	Đ	Ö	b
45	Tabelle	BspNr.			!								
	Tabe	Bsp.	742	743	744	745	746	747	748	749	750	751	752

EP 0 456 063 A2

		Fp° C									>		്ര
10		R ²	C2H5	$(CH_3)_2CH$	(сн ³) ⁵ сн-сн ⁵ -	C ₂ H ₅ -CH- CH ₃	-э ^є (снз)	- ² нэ-э [€] (^E нэ)		C ₂ H ₅ O	C2H50	\Diamond	C2H5-0~~CH3
15													
20		æ	снз	снз	CH3	СНЗ	снз	снз	CH ₃	снз	снэ	снз	снз
													_
25		V	i-C3H7	i-c ₃ H7	i-C ₃ H ₂	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₂	i-c ₃ H ₇	i-C3H7	i-C ₃ H ₇	i -C3H7	i-c ₃ H ₂
30	-	Zn	6-CH ₃	6-CH3	6-CH ₃	6-сн ₃	6-СН3	6-CH3	6-CH ₃	€-СН3	6-CH ₃	6-CH ₃	6-СН3
35	(Buna	Y	CH3	CH ₃	снз	снз	СНЗ	снз	снз	CH ₃	снз	снз	снз
40	(Fortsetzung)	×	CH3	CH ³	снз	снз	CH ₃	снз	CH ₃	снз	снз	снэ	снз
45	Tabelle 3	BspNr.	753	754	755	756	757	758	759	260	761	762	763

EP 0 456 063 A2

		Fp° C	енэ		ıo							-	٠
5			\	CH ₃	C2HS				CH2-			-CH2-	
10		R ²	(сн ³) ² сн-о	C3H2-0	C2H5-0	СН ^З	C ₂ H ₅	(сн ³) ² сн-	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	C ₂ H ₅ -CH-	(сн ³) ³ с-	(CH ₃) ₃ C-CH ₂	\bigcirc
15													
20		В	CH3	СНЗ	СНЗ	-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂)4-	-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂)4-	-(CH ₂)4-	-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂) ₄ -
25		A	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	0)-	0)-	0)-	0)-	0) -	0) -	0)-	0)-
30		Zn	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃	€-сн3	6-СН3	6-CH ₃	6-CH ₃	6-CH ₃
35	(buna	٨	снз	снз	снз	×	CH3	CH3	. EHO	СНЗ	CH ₃	снз	снз
40	(Fortsetzung)	×	снэ	снз	снз	снэ	CH ₃	CH ₃	CH ₃	снэ	снз	снз	снз
45	Tabelle 3	BspNr.	764	765	992	292	768	.692	270	771	772	773	774

EP 0 456 063 A2

45	40	35	30	25	20	15	10	5
Tabelle 3	(Fortsetzung)	(bun						
BapNr.	×	٨	2 _n	4	В	R ²		Fp° C
275	снэ	СНЭ	6-CH ₃	-(CH2)4-	74-	O	C2H50	\ \
776	снз	снз	€-сн ³	-(CH ₂) ₄ -)4-	O	C2H50	>
777	снэ	снэ	€н⊃-9	-(CH ₂)4-	- 5(
778	снз	снз	6-СН3	-(CH ₂) ₄ -	- 4-	ບິ	C2H5-0	CH ₃
779	снз	снэ	€-сн³	-(CH ₂) ₄ -	-4-	HO)	О-но²(Ено)	CH ₃
780	снз	снз	6-сн3	-(CH ²)4-	-6(ц ^е	C3H2-0-7HE2	EH3
781	снэ	снэ	€-СН3-9	-(CH ₂) ₄ -)4-	C2H	C2H5-0~	°C2H5
9	ē	3	10° 7		1	č		
783	c E E	r S	6-CH2	-(CH2)5-	'5-) _E -	Cn3 CoHe	<u>u</u>	
784	CH3	CH ₃	EHO-9	-(CH2)-		CH CH	сн ₃) ₂ сн-	
785	CH ₃	cH ₃	EH2-9	-(CH ²)2-) ₅ -	E)	(снз)2сн-сн2-	H2-
786	CH ₃	снз	6-сн3	-(CH ₂) ₅ -	.2-	C2H	С ₂ Н5-СН- СН3	

		Fp° C					\			снэ		
5		F		-21		\	\ \{		СН3	\	CH3	C2H5
10		R ²	-2 ^E (CH ²)	(CH ³) ³ C-CH ² -		C2H50	C ₂ H ₅ O		C2H5-0	(сн³) ² сн-0∕	C3H7-0~	C2H5-0
15												
20		В	-(CH ₂)5-	-(CH ₂)5-	-(CH ₂) ₅ -	-(CH ₂) ₅ -	-(CH ²)2-	-(CH ₂) ₅ -				
25		4										
30	·	Z _n	€-сн³	€-сн ³	6-CH ₃	€Hጋ-9	6-CH ₃	е-сн ³	6-CH ₃	€-сн³	ено-9	6-CH ₃
35	(Bunz	*	снэ	снз	CH3	снз	CH ₃	CH3	CH3	снз	снэ	снз
40 .	(Fortsetzung)	×	СНЭ	снэ	снз	снэ	CH ₃	снз	EH2	снз	СНЗ	снз
45	Tabelle 3	BspNr.	787	788	789	790	791	792	793	794	795	962

50

Beispiel (III)

138 g (0.5 Mol) N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-valin werden in 500 ml Methanol suspendiert, mit 73 ml (0.55 Mol) Dimethoxypropan versetzt und nach Zugabe von 4,75 g (25 mmol) p-Toluolsulfonsäure-monohydrat und Dünnschicht-Chromatographie (DC)-Kontrolle unter Rückfluß erhitzt.

Nach Abrotieren des Lösungsmittels nimmt man den Rückstand in Methylenchlorid auf, wäscht mit Natriumhydrogencarbonat-Lösung, trocknet und rotiert ein.

Ausbeute: 127,6 g (= 88 % d.Th.)

Beispiel (Ila1)

20

25

30

35

50

58.8 g (0,5 Mol) L-Valin in 720 ml Wasser werden mit 10 g (0,25 Mol) NaOH-Plätzchen versetzt. Anschließend werden synchron 30 g (0,75 Mol) NaOh-Plätzchen in 150 ml Wasser und 98,2 g (0,5 Mol) Mesitylenessigsäurechlorid so zugetropft, daß die Temperatur 40°C, nicht überschreitet. Nach 1 h wird bei 0-20°C mit konz. Salzsäure angesäuert, das Produkt abgesaugt und i.Vak. bei 70°C über Diphosphorpentoxid getrocknet.

Ausbeute: 138 g (= 100 % d.Th.) Fp. 140 °C.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe der Formel (I) eignen sich bei guter Pflanzenverträglichkeit und günstiger Warmblütertoxizität zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere der Klasse Arachnida und der Ordnung Milben (Acarina), die in der Landwirtschaft, in Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen. Sie sind gegen normal sensible und resistente Artn sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam. Zu den oben erwähnten Schädlingen gehören:

Aus der Ordnung der Acarina z.B. Acarus siro, Argas spp., Ornithodoros spp., Dermanyssus gallinae, Eriophyes ribis, Phyllocoptruta oleivora, Boophilus spp., Rhipicephalus spp., Amblyomma spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp., Bryobia praetiosa, Panonychus spp., Tetranychus spp..

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe wirken nicht nur gegen Pflanzen-, Hygiene- und Vorratsschädlinge, sondern auch auf dem veterinärmedizinischen Sektor gegen tierische Parasiten (Ektoparasiten) wie Schildzecken, Lederzecken, Räudemilben, Laufmilben.

Sie sind gegen normalsensible und resistente Arten und Stämme, sowie gegen alle parasitierenden und nicht parasitierenden Entwicklungsstadien der Ektoparasiten wirksam.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe zeichnen sich durch eine hohe akarizide Wirksamkeit aus. Sie lassen sich mit besonders gutem Erfolg gegen pflanzenschädigende Milben, wie wie beispielsweise gegen die gemeine Spinnmilbe (Tetranychus urticae) einsetzen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können weiterhin als Defoliants, Desiccants, Krautabtötungsmittel

und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

Charakteristisch für die erfindungsgemäßen Verbindungen ist, daß sie eine selektive Wirksamkeit gegen monokotyle Unkräuter im Vor- und Nachlaufverfahren (Pre- und Postemergence) bei guter Kulturpflanzenverträglichkeit aufweisen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca, Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum, Agropyron, Cynodon, Monochoria, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Sphenoclea, Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus, Apera.

Monokotyle Kulturen der Gattungen: Oryza, Zea, Triticum, Hordeum, Avena, Secale, Sorghum, Panicum, Saccharum, Ananas, Asparagus, Allium.

Dikotyle Kulturen der Gattungen: Gossypium, Glycine, Beta, Daucus, Phaseolus, Pisum, Solanum, Linum, Ipomoea, Vicia, Nicotiana, Lycopersicon, Arachis, Brassica, Lactuca, Cucumis, Cucurbita.

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen.

Die Verbindungen eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die Verbindungen zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Ziergehölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuß-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen und zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

Dabei zeigen die erfindungsgemäßen Wirkstoffe neben einer hervorragenden Wirkung gegen Schadpflanzen gute Verträglichkeit gegenüber wichtigen Kulturpflanzen, wie z. B. Weizen, Baumwolle, Sojabohnen, Citrusfrüchten und Zuckerrüben, und können daher als selektive Unkrautbekämpfungsmittel eingesetzt werden.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, ferner in Formulierungen mit Brennsätzen, wie Räucherpatronen, -dosen, -spiralen u.ä., sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser; mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgas, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid; als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kleselsäure, Aluminiumoxid und Silikate; als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengel; als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylarylpolyglykol-Ether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit anderen Wirkstoffen, wie Insektiziden, Lockstoffen, Sterilantien, Akariziden, Nematiziden Herbiziden oder Fungiziden vorliegen. Zu den Insektiziden zählen beispielsweise Phosphorsäureester, Carbamate, Carbonsäureester, chlorierte Kohlenwasserstoffe, Phenylharnstoffe, durch Mikroorganismen hergestellte Stoffe u.a.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können ferner in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit Synergisten vorliegen. Synergisten sind Verbindungen, durch die die Wirkung der Wirkstoffe gesteigert wird, ohne daß der zugesetzte Synergist selbst aktiv wirksam sein muß.

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann in weiten Bereichen variieren. Die Wirkstoffkonzentration der Anwendungsformen kann von 0,0000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,0001 und 1 Gew.-% liegen.

Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepaßten üblichen Weise.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von Milben, Zecken usw. auf dem Gebiet der Tierhaltung und Viehzucht, wobei durch die Bekämpfung der Schädlinge bessere Ergebnisse, z.B. höhere Milchleistungen, höheres Gewicht, schöneres Tierfell, längere Lebensdauer usw. erreicht werden können.

Die Anwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geschieht auf diesem Gebiet in bekannter Weise wie durch orale Anwendung in Form von beispielsweise Tabletten, Kapseln, Tränken, Granulaten, durch dermale bzw. äußerliche Anwendung in Form beispielsweise des Tauchens (Dippen), Sprühens (Sprayen), Aufgießens (pour-on and spot-on) und des Einpuderns sowie durch parenterale Anwendung in Form beispielsweise der Injektion sowie ferner durch das "feed-through"-Verfahren. Daneben ist auch eine Anwendung als Formkörper (Halsband, Ohrmarke) möglich.

Bei den im folgenden aufgeführten biologischen Beispielen wurden folgende Verbindungen als Vergleichssubstanzen eingesetzt:

A)

35

bekannt aus DE-A 2 361 084 und US-A 4 632 698
 B)

bekannt aus DE-A 2 361 084 und US-A 4 632 698
 C)

55

bekannt aus DE-A 2 361 084 und US-A 4 632 698

10 Beispiel A

5

15

30

45

50

Phaedon-Larven-Test

Lösungsmittel:

7 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und der angegebenen Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Kohlblätter (Brassica oleracea) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Meerrettichblattkäfer-Larven (Phaedon cochleariae) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, daß alle Käfer-Larven abgetötet wurden; 0 % bedeutet, daß keine Käfer-Larven abgetötet wurden.

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele überlegene Wirksamkeit gegenüber dem Stand der Technik:

(1), (2), (32), (40), (278), (280), (290), (299).

Beispiel B

Plutella-Test

Lösungsmittel:

7 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und der angegebenen Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Kohlblätter (Brassica oleracea) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Raupen der Kohlschabe (Plutella maculipennis) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, daß alle Raupen abgetötet wurden; 0 % bedeutet, daß keine Raupen abgetötet wurden.

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele überlegene Wirksamkeit gegenüber dem Stand der Technik: (1), (32), (283), (299).

Beispiel C

Nephotettix-Test

7 Gewichtsteile Dimethylformamid

Lösungsmittel: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether Emulgator:

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und der angegebenen Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Reiskeimlinge (Oryza sativa) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Larven der Grünen Reiszikade (Neophotettix cincticepa) besetzt, solange die Keimlinge noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, daß alle Zikaden

abgetötet wurden; 0 % bedeutet, daß keine Zikaden abgetötet wurden.

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele überlegene Wirksamkeit gegenüber dem Stand der Technik: (1), (32), (43), (290), (292), (299), (301).

5 Beispiel D

Pre-emergence-Test

Lösungsmittel:

7 Gewichtsteile Aceton

10 Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und der angegebenen Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät und nach 24 Stunden mit der Wirkstoffzubereitung begossen. Dabei hält man die Wassermenge pro Flächeneinheit zweckmäßigerweise konstant.
Die Wirkstoffkonzentration in der Zubereitung spielt keine Rolle, entscheidend ist nur die Aufwandmenge
des Wirkstoffs pro Flächeneinheit. Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in %
Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrollen. Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle

100 % = totale Vernichtung

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele überlegene Wirksamkeit gegenüber dem Stand der Technik: (32), (281), (283).

Beispiel E

25

20

Post-emergence-Test

Lösungsmittel:

7 Gewichtsteile Aceton

Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und der angegebenen Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5 - 15 cm haben so, daß die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit ausgebracht werden. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, daß in 2000 I Wasser/ha die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen ausgebracht werden. Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle. Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle

100 % = totale Vernichtung

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele überlegene Wirksamkeit gegenüber dem Stand der Technik: (32), (281), (283).

Beispiel F

45 Tetranychus-Test (OP-resistent)

Lösungsmittel:

7 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und der angegebenen Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschten Konzentrationen.

Bohnenpflanzen (Phaseolus vulgaris), die stark von allen Entwicklungsstadien der gemeinen Spinnmilbe oder Bohnenspinnmilbe (Tetranychus urticae) befallen sind, werden mit einer Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration tropfnaß gespritzt.

Nach der gewünschten Zeit wird die Wirkung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, daß alle Spinnmilben abgetötet wurden; 0 % bedeutet, daß keine Spinnmilben abgetötet wurden.

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele überlegene Wirksamkeit gegenüber dem Stand der Technik: (281), (283).

Patentansprüche

20

25

30

35

40

45

55

1. 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I)

in welcher

X für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,
Y für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl steht,
Z für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

n für eine Zahl von 0-3 steht,
R für Wasserstoff oder für die Gruppen
-CO-R1, -CO-O-R2 oder für E®
steht, in welchen

R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, Polyalkoxyalkyl und Cycloalkyl, das durch Heteroatome unterbrochen sein kann, gegebenenfalls subst. Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylalkyl, substituiertes Hetaryl, substituiertes Phenoxyalkyl und substituiertes Hetaryloxyalkyl steht und

R² für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl und gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Cycloalkyl steht,

A für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gegebenenfalls durch Heteroatome unterbrochenes Cycloalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen-, Alkyl-, Halogenalkyl-, Alkoxy-, Nitro substituiertes Aryl, Arylalkyl oder Hetaryl steht,

B für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht,

oder worin

A und B gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom an das sie gebungen sind einen Carbocyclus bilden und

E® für ein Metallionäquivalent oder einen Ammoniumion steht,

sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (I).

2. 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

X für C₁-C₆-Alkyl, Halogen, C₁-C₆-Alkoxy steht,

Y für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Halogen, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkyl steht,

Z für C₁-C₆-Alkyl, Halogen, C₁-C₆-Alkoxy steht,

n für eine Zahl von 0-3 steht,

R für Wasserstoff (la) oder für die Gruppen der Formel

-CO-R1 (lb) oder -CO-O-R2 (lc)

oder E[®] (Id)

steht, in welchen

R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₂₀-Alkyl, C₂-C₂₀-Alkenyl,

C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Alkylthio-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Polyalkoxy-C₂-C₈-alkyl und Cycloalkyl mit 3-8 Ringatomen, das durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann, steht,

		für gegebenenfalls durch Halogen-, Nitro-, C_1 - C_6 -Alkyl-, C_1 - C_6 -Alkoxy-, c_1 - C_6 -Halogenalkyl-, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy-substituiertes Phenyl;
5		für gegebenenfalls durch Halogen-, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy-, C_1 - C_6 -Halogenalkyl-, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy-substituiertes Phenyl- C_1 - C_6 -alkyl steht,
		für gegebenenfalls durch Halogen- und C ₁ -C ₆ -Alkyl-substituiertes Hetaryl steht,
10		für gegebenenfalls durch Halogen- und $C_1\text{-}C_6\text{-}Alkyl\text{-}substituiertes}$ Phenoxy- $C_1\text{-}C_6\text{-}alkyl\text{-}steht$,
		für gegebenenfalls durch Halogen, Amino und C_1 - C_6 -Alkyl-substituiertes Hetaryloxy- C_1 - C_6 -Alkyl steht,
15	R²	für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes: C_1 - C_{20} -Alkyl, C_2 - C_{20} -Alkenyl, C_1 - C_8 -Alkoxy- C_2 - C_8 -alkyl, C_1 - C_8 -Polyalkoxy- C_2 - C_8 -alkyl steht,
	A	für gegebenenfalls durch Halogen-, Nitro-, C ₁ -C ₆ -Alkyl-, C ₁ -C ₆ -Alkoxy-, C ₁ -C ₆ -Halogenalkyl substituiertes Phenyl oder Cycloalkyl mit 3-8 Ringatomen steht, für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder
20	A	verzweigtes C ₁ -C ₁₂ -Alkyl, C ₃ -C ₈ -Alkenyl, C ₃ -C ₈ -Alkinyl, C ₁ -C ₁₀ -Alkoxy-C ₂ -C ₈ -alkyl, C ₁ -C ₈ -Polyalkoxy-C ₂ -C ₈ -alkyl, C ₁ -C ₁₀ -Alkylthio-C ₂ -C ₈ -alkyl, Cycloalkyl mit 3-8 Ringatomen, das durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch Halogen, C ₁ -C ₆ -Alkyl-C ₁ -C ₆ -Halogenalkyl-, C ₁ -C ₆ -Alkoxy, Nitro substituiertes Aryl,
25	В,	Hetaryl oder Aryl-C ₁ -C ₆ -alkyl steht, für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes oder verzweigtes C ₁ -C ₁₂ -Alkyl, C ₁ -C ₈ -Alkyl oder
	A und B	Alkoxyalkyl steht, oder gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind einen 3-8 gliedrigen Ring bilden oder
	E•	für einen Metallionenäquivalent oder ein Ammoniumion steht
30		sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (I).
		din-2,4-dion-Derivat der Formel (I) gemäß Anspruch 1 oder 2, in welcher
35	X Y	für C_1 - C_4 -Alkyl, Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy steht, für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_2 -Halogenalkyl steht,
	Z	für C ₁ -C ₄ -Alkyl, Halogen, C ₁ -C ₄ -Alkoxy steht,
	n	für eine Zahl von 0-3 steht,
	R	für Wasserstoff (la) oder für die Gruppen der Formel
40		-CO-R¹ (lb), -CO-O-R² (lc) oder E [•] (ld)
		steht, in welchen
	. R ¹	für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C ₁ -C ₁₆ -Alkyl, C ₂ -C ₁₆ -Alkenyl, C ₁ -C ₆ -
45		Alkoxy- C_2 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -Alkylthio- C_2 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -Polyalkoxy- C_2 - C_6 -alkyl und Cycloalkyl mit 3-7 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff-und/oder Schwefelatome unterbrochen sein kann steht,
50		für gegebenenfalls durch Halogen-, Nitro-, C ₁ -C ₄ -Alkyl-, C ₁ -C ₆ -Alkoxy-, C ₁ -C ₃ -Halogenalkyl-, C ₁ -C ₃ -Halogenalkoxy-substituiertes Phenyl steht,
50		für gegebenenfalls durch Halogen-, C_1 - C_4 -Alkyl-, C_1 - C_4 -Alkoxy-, C_1 - C_3 -Halogenalkyl-, C_1 - C_3 -Halogenalkoxy-substituiertes Phenyl- C_1 - C_4 -alkyl steht,
55		für gegebenenfalls duch Halogen- und C ₁ -C ₆ -Alkyl-substituiertes Hetaryl steht,
-		gegebenenfalls für durch Halogen- und C_1 - C_4 -Alkyl-substituiertes Phenoxy- C_1 - C_5 -alkyl steht,

	R ²	für gegebenfalls durch Halogen, Amino und C_1 - C_4 -Alkyl-substituiertes Hetaryloxy- C_1 - C_5 -alkyl steht, für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C_1 - C_{16} -Alkyl, C_2 - C_{16} -Alkenyl, C_1 - C_{16} -Alkoxy- C_2 - C_6 -alkyl, C_1 - C_5 -Polyalkoxy- C_2 - C_6 -alkyl steht,
5		für gegebenenfalls durch Halogen, Nitro-, C ₁ -C ₄ -Alkyl, C ₁ -C ₃ -Alkoxy-, C ₁ -C ₃ -Halogenalkyl-substituiertes Phenyl steht,
10	Α	für Wasserstoff gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C_1 - C_{10} -Alkyl, C_3 - C_6 -Alkenyl, C_3 - C_6 -Alkinyl, C_1 - C_8 -Alkoxy- C_2 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -Polyalkoxy- C_2 - C_6 -alkyl, C_1 - C_8 -Alkylthio- C_2 - C_6 -alkyl, Cycloalkyl mit 3-7 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff-und/oder Schwefelatome unterbrochen sein kann oder geebenenfalls durch Halogen-, C_1 - C_4 -Alkyl-, C_1 - C_4 -Halogenalkyl- C_1 - C_4 -Alkoxy-Nitro , substituier-
15	В	tes Aryl, Hetaryl oder Aryl-C ₁ -C ₄ -alkyl steht, für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes C ₁ -C ₁₀ -Alkyl, C ₁ -C Alkoxyalkyl steht oder
	A und B	gemelnsam mit dem Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind einen 3-7-gliedrigen Ring bilden und
20	E®	für ein Metallionenäquivalent oder ein Ammoniumion steht,
		sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (i).
4.	3-Aryl-pyrrolic	din-2,4-dion-Derivate der Formel (I) gemäß Anspruch 1 bis 3, in welcher
25	X	für Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy und Ethoxy steht,
	Υ	für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl, Butyl, i-Butyl, tertButyl, Fluor, Chlor,
	7	Brom, Methoxy, Ethoxy und Trifluormethyl steht, für Methyl, Ethyl, i-Propyl, Butyl, i-Butyl, tertButyl, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy und
	Z	Ethoxy steht,
30	n	für eine Zahl von 0-3 steht,
••	R	für Wasserstoff (la) oder für die Gruppen der Formel
		-CO-R1 (ib), -CO-O-R2 (ic) oder E ^e (id)
35		steht, in welcher
33	R¹	für gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes: C_1-C_{14} -Alkyl, C_2-C_{14} -Alkenyl, C_1-C_4 -Alkoxy- C_2-C_6 -alkyl, C_1-C_4 -Alkylthio- C_2-C_6 -alkyl, C_1-C_4 -Polyalkoxyl- C_2-C_4 -alkyl und Cycloalkyl mit 3-6 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff-und/oder Schwefelatome unterbrochen sein kann steht,
40		für gegebenenfalls durch Fluor- Chlor Brom- Methyl- Ethyl- Propyl, i-Propyl, Me-
		thoxy, Ethoxy, Trifluormethyl-, Trifluormethoxy-, Nitro- substituiertes Phenyl steht,
45		für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Brom-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy-substituiertes Phenyl-C ₁ -C ₃ -alkyl steht,
		für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Brom-, Methyl-, Ethyl-substituiertes Pyridyl, Pyrimidyl, Thiazolyl und Pyrazolyl steht,
50		für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Methyl-, Ethyl-substituiertes Phenoxy- C_1 - C_4 -alkylsteht,
55	R²	für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Amino-, Methyl-, Ethyl-, substituiertes Pyridyloxy- C_1 - C_4 -alkyl, Pyrimidyloxy- C_1 - C_4 -alkyl und Thiazolyloxy- C_1 - C_4 -alkyl steht, für gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1 - C_1 4-Alkyl, C_2 - C_1 4-Alkenyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_2 - C_6 -alkyl, C_1 - C_4 -Polyalkoxy- C_2 - C_6 -alkyl steht
		odor

oder

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Nitro-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, i-Propyl-, Methoxy-, Ethoxy-, Trifluormethyl-substituiertes Phenyl steht,

- für Wasserstoff gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₄-Alkenyl, C₃-C₄-Alkinyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₄-alkyl, C₁-C₄-Polyalkoxy-C₂-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylthio-C₂-C₄-alkyl, Cycloalkyl mit 3-6 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff- und/oder Schwefelatomen unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Brom-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, iso-Propyl-, Methoxy-, Ethoxy-, Trifluormethyl-, Nitro substituiertes Aryl, Pyridin, Imidazol, Pyrazol, Triasol, Indol, Thiazol oder
- B für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxyalkyl steht, oder
- A und B gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind ein 3-6 gliedrigen Ring bilden, und
- 15 E für ein Metallionenäquivalent oder ein Ammoniumion steht sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel I.
 - 5. Verfahren zur Herstellung von 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivaten der (I)

 $\begin{array}{c|c}
A & R-0 & X \\
\hline
B & X \\
\hline
N & 0
\end{array}$

in welcher

Α

5

10

20

25

30

35

40

45

50

X für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

Y für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl steht,

Z für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

n für eine Zahl von 0-3 steht,

R für Wasserstoff oder für die Gruppen

-CO-R1, -CO-O-R2

steht, in welchen

- R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, Polyalkoxyalkyl und Cycloalkyl, das durch Heteroatome unterbrochen sein kann, gegebenenfalls subst. Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylalkyl, substituiertes Hetaryl, substituiertes Phenoxyalkyl und substituiertes Hetaryloxyalkyl steht und
- R² für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl und gegebenenfalls substituiertes Phenyl steht,
- A für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, , Alkylthioalkyl, gegebenenfalls durch Heteroatome unterbrochenes Cycloalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl-, Haloalkyl-, Alkoxy-, Nitro substituiertes Aryl, Arylalkyl oder Hetaryl steht,
- B für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht,

oder worin

- A und B gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind einen Carbocyclus bilden und
 - E* für einen Metallionäquivalent oder ein Ammoniumion steht, dadurch gekennzeichnet,
- 55 daß man zum Erhalt von 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dionen bzw. deren Enolen der Formel (la)

in welcher A, B, C, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben, (A)

N-Acylaminosäureester der Formel (II)

in welcher

A, B, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben

und

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

R3 für Alkyl steht,

in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart einer Base intramolekular kondensiert, (B)

oder daß man zum Erhalt von Verbindungen der Formel (lb)

$$\begin{array}{c|c}
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\$$

in welcher A, B, X, Y, Z, R1 und n die oben angegebene Bedeutung haben,

Verbindungen der Formel (la),

in welcher

A, B, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben,
 α) mit Säurehalogeniden der allgemeinen Formel (III)

5

10

15

20

in welcher

R1 die oben angegebene Bedeutung hat

und

Hal für Halogen, insbesondere Chlor und Brom steht, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines

oder

β) mit Carbonsäureanhydriden der allgemeinen Formel (IV)

R1-CO-O-CO-R1 (IV)

Säurebindemittels,

in welcher

R1 die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels,

umsetzt,

(C)

25

30

oder daß man zum Erhalt von Verbindungen der Formel (Ic)

 $\begin{array}{c|c}
R^{2}O-C-O & X \\
\hline
A & & & \\
H-N & O
\end{array}$

35

in welcher

A, B, C, X, Y, Z, R² und n die oben angegebene Bedeutung haben,

40

Verbindungen der Formel (la)

45

50

in welcher

A, B, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Chlorameisensäureester der allgemeinen Formel (V)

55

R2-O-CO-CI (V)

in welcher

R² die oben angegebene Bedeutung hat, gegebenenfals in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt,

D١

oder daß man zum Erhalt von Verbindungen der Formel (ld)

15

5

10

in welcher X, Y, Z, A, B und n die oben angegebene Bedeutung haben,

Verbindungen der Formel (la)

20

$$A \xrightarrow{B} HO X \xrightarrow{Z_n} Y \qquad (Ia)$$

25

in welcher X, Y, Z, A, B und n die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Metallhydroxiden oder Aminen der allgemeinen Formeln (VI) und (VII)

Me_sOH_t (VI)

35

45

50

30

40 in welchen

Me

für ein- oder zweiwertige Metallionen,

s und t

für die Zahl 1 und 2 und

R⁴, R⁵ und R6

unabhängig voneinander für Wasserstoff und Alkyl

stehen,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, umsetzt.

- Insektizide, akarizide und herbizide Mittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivat der Formel (I).
- 7. Verfahren zur Bekämpfung von Insekten und/oder Spinnentieren und/oder Unkräutern, dadurch gekennzeichnet, daß man 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I) auf Insekten und/oder Spinnentieren und/oder Unkräutern und/oder deren Lebensraum einwirken läßt.
- 55 8. Verwendung von 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivaten der Formel (I) zur Bekämpfung von Insekten und/oder Spinnentieren und/oder Unkräutern.
 - 9. Verfahren zur Herstellung von insektiziden und/oder akariziden und/oder herbiziden Mitteln, dadurch

gekennzeichnet, daß man 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I) mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Mitteln vermischt.

..

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(21) Anmeldenummer: 91106870.8

Anmeldetag: 27.04.91

(i) Int. Cl.5: **C07D** 207/38, C07D 209/54, C07D 207/408, C07D 403/12, C07D 207/404, C07D 405/12, A01N 43/36

Priorität: 10.05.90 DE 4014941 08.03.91 DE 4107394

Veröffentlichungstag der Anmeldung: 13.11.91 Patentblatt 91/46

84) Benannte Vertragsstaaten: BE CH DE ES FR GB GR IT LI NL

 Veröffentlichungstag des später veröffentlichten Recherchenberichts: 08.07.92 Patentblatt 92/28

(7) Anmelder: BAYER AG

W-5090 Leverkusen 1 Bayerwerk(DE)

Erfinder: Krauskopf, Birgit, Dr. Kicke 19 W-5060 Bergisch Gladbach 1(DE) Erfinder: Lürssen, Klaus, Dr. August-Kierspei-Strasse 151 W-5060 Bergisch Gladbach(DE) Erfinder: Santel, Hans-Joachim, Dr.

Gruenstrasse 9a

W-5090 Leverkusen 1(DE) Erfinder: Schmidt, Robert R., Dr.

Im Waldwinkel 110

W-5060 Bergisch Gladbach(DE)

Erfinder: Wachendorff-Neumann, Ulrike, Dr.

Kriescherstrasse 81 W-4019 Monhelm(DE) Erfinder: Flscher, Reiner, Dr. Nelly-Sachs-Strasse 23 W-4019 Monheim 2(DE)

Erfinder: Erdelen, Christoph, Dr.

Unterbuescherhof 22 W-5653 Leichlingen 1(DE)

4 1-H-3-Aryl-pyrrolldin-2,4-dion-Derivate.

57 Es werden neue 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der allgemeinen Formel (I)

bereitgestellt, in welcher

Х für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

Υ für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl steht,

Z für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

n für eine Zahl von 0-3 steht.

für Wasserstoff oder für die Gruppen R

-CO-R1, -CO-O-R2 oder E® steht, in welchen

 R^1 für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, Polyalkoxyalkyl und Cycloalkyl, das durch Heteroatome unterbrochen sein kann, gegebenenfalls subst. Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylalkyl, substituiertes Hetaryl, substituiertes Phenoxyalkyl und substituiertes Hetaryloxyalkyl steht und

 R^2 für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl und gegebenenfalls substituiertes Phenyl steht.

Α für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gegebenenfalls durch Hetero-

atome unterbrochenes Cycloalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen-, Alkyl-, Halogenalkyl-, Alkoxy-, Nitro substituiertes Aryl, Arylalkyl oder Hetaryl steht,

B für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht,

oder worin

A und B gemeinsam mit dem Kohlenstoff-

atom, an das sie gebunden sind einen Carbocyclus bilden und

F° für ein Metallionäquivalent oder ein Ammoniumion steht,

sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel

Die neuen Verbindungen der Formel (I) besitzen eine hervorragende herbizide, insektizide und akarizide Wirksamkeit.

EUROPÄISCHER RECHERCHENBERICHT

EP 91 10 6870

V-4	Kennzeichnung des Dokuments m	it Angabe, soweit erforderlich,	Betrifft	KLASSIFIKATION DER
Kategorie	der maßgeblichen 1	l'eile	Anspruch	ANMELDUNG (Int. CL5)
D,Y	US-A-4 632 698 (UNION CARBI	IDE CORPORATION) 30.	1-9	C070207/38
Ť	Dezember 1986			C07D209/54
	Beispiel II, Spalte 7; Ver	rbindungen 1-18 in		C07D2D7/4D8
	Tabelle I			C070403/12
	* Spalte 4, Zeile 55 - Spal	lte 5, Zeile 34 *	1 1	C070207/404
i	* Spalte 5, Zeile 59 - Zei	le 64 *	1	CO7D405/12
				A01N43/36
Y	US-A-3 272 842 (ELI LILLY /	AND COMPANY) 13,	1-9	
	September 1966			
	Beispiel 2 ; Anspruch 4			
- 1	* Spalte 3, Zeile 23 - Zei			
l	* Spalte 3, Zeile 43 - Zei			
	* Spalte 4, Zeile 5 - Zeile	e 12 *		
γ	WO-A-8 804 652 (NIPPON SODA	CO 1TO 130 Junt	1-9	
۱ ا	1988	·,,,		
- 1	* das ganze Dokument *			
	301150			
P.Y	EP-A-0 377 893 (BAYER AG)	18, Julf 1990	1-9	
· •	* das ganze Dokument *			
		•		RECHERCHIERTE
P,Y	EP-A-0 415 185 (BAYER AG) (5. März 1991	1-9	SACHGEBIETE (Int. Cl.5
	* das ganze Dokument *			
	-			C07D
P,Y	EP-A-0 423 482 (BAYER AG) 2	24. April 1991	1-9	ADIN
	* das ganze Dokument *			
D,A	DE-A-2 361 084 (UNION CARB)	IDE CORPORATION) 20.	1-9	
	Junt 1974			
	* das ganze Dokument *			
	•		1	
i			1	
				,
Der vo	rliegende Recherchenbericht wurde für	alle Patentansprüche erstellt	1 :	
	Recharchement	Abschinfeletun der Racherche	1	Prefer
	MUENCHEN	07 MAI 1992	HART	RAMPF G.W.
,	KATEGORIE DER GENANNTEN DOKU	MENTR T: 4se Esfindama	morande Heerade	Theorien oder Grundskize
	besonderer Bedeutung allein betrachtet	E : Elteres Patente	okument, das jedo eldedatum veröffet	ch erst am oder
	CHARLES IN CHARLETON BUILDING BARTACHTAL	DECD SOR AST		HILLER WITH IN

EPO PORM 15th that (Post)

- x i von sesoneere fletsetung in Verhindung nitt anderen Veröffentlichung derselben Kanegorie A : technologischer Hintergrund O : zichtschriftliche Offenbarung P : Zwischenliterstur

- L : ans anders Grinden angeführtes Dokument
- & : Mitglied der gleichen Patentfamille, übereinstimmendes Dokument